(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



(43) 国際公開日 2002年8月15日 (15.08.2002)

PCT

(10) 国際公開番号 WO 02/062770 A1

(51) 国際特許分類7: C07D 261/10, 261/12, 413/12, 498/04, 513/04, 413/14, 417/12, 261/20, 487/04, A01N 43/80

(21) 国際出願番号:

PCT/JP02/01015

(22) 国際出願日:

2002年2月7日 (07.02.2002)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ: 2001年2月8日(08.02.2001) 特願2001-031784

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): クミア イ化学工業株式会社 (KUMIAI CHEMICAL INDUS-TRY CO., LTD.) [JP/JP]; 〒110-0008 東京都 台東区 池 之端 1 丁目 4 番 2 6 号 Tokyo (JP). イハラケミカル 工業株式会社 (IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.) [JP/JP], 〒110-0008 東京都 台東区 池之端 1 丁 目 4 番 2 6 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 中谷 昌央 (NAKATANI,Masao) [JP/JP]; 〒 437-1213 静岡県磐田郡福田町塩新田 4 0 8番地の 1 株式会社 ケイ・アイ研究所内 Shizuoka (JP). 久語 良太郎 (KUGO,Ryotaro) [JP/JP]; 〒590-0531 大阪府 泉南 市 岡田5丁目27番23号 Osaka (JP). 宮崎 雅 弘 (MMIYAZAKLMasahiro) [JP/JP]; 〒 437-1213 静 岡県 磐田郡 福田町塩新田408番地の1 株式 会社ケイ・アイ研究所内 Shizuoka (JP). 角 康一郎 (KAKU,Koichiro) [JP/JP]; 〒437-1207 静岡県 磐田郡 福田町蛭池276番地の1 Shizuoka (JP). 藤波周 (FUJINAMI,Makoto) [JP/JP]; 〒439-0031 静岡県 小笠 郡 菊川町加茂 1809番地 Shizuoka (JP). 上野 良 平 (UENO, Ryohei) [JP/JP]; 〒439-0031 静岡県 小笠 郡 菊川町加茂 1809番地 Shizuoka (JP). 高橋 智 (TAKAHASHI,Satoru) [JP/JP]; 〒420-0046 静岡県静 岡市 吉野町 5番地の18 Shizuoka (JP).

(74) 代理人: 小林 雅人 (KOBAYASHI, Masato); 〒162-0825 東京都 新宿区 神楽坂4丁目3番地 煉瓦塔ビル5階 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特 許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、 定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: ISOXAZOLINE DERIVATIVE AND HERBICIDE COMPRISING THE SAME AS ACTIVE INGREDIENT

(54) 発明の名称: イソオキサゾリン誘導体及びこれを有効成分とする除草剤

(57) Abstract: An isoxazoline derivative which is represented by the general formula: [I] wherein R¹ and R² represent an alkyl group and may be the same or different, R³, R⁴, R⁵ and R⁶ represent a hydrogen atom, Y represents an aromatic heterocyclic group or atom, has five or six members, and may be substituted, and n represents an integer of 0 to 2. The isoxazoline derivative exhibits excellent herbicidal effect and selectivity between a crop and a weed

(57) 要約:

本発明は、優れた除草効果と作物・雑草間の選択性を有するイソオキサゾリン誘導体を提供することを課題とする。

本発明のイソオキサゾリン誘導体は、一般式

[式中、

R¹及びR²は、同一又は異なって、アルキル基を示し、

R3, R4, R5, R6は、水素原子を示し、

Yは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子より選択される任意のヘテロ原子を有する 5~6員の置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基又は芳香族ヘテロ縮合環基を 示し、

nは0~2の整数を示す。]

で表される。

明細書

イソオキサゾリン誘導体及びこれを有効成分とする除草剤

5 技術分野

本発明は新規なイソオキサゾリン誘導体及びそれを有効成分として含有する除 草剤に関するものである。

背景技術

10 イソオキサゾリン誘導体が除草活性を有することは、例えば、特開平8-22558 号公報、特開平9-328477号公報及び特開平9-328483号公報等に報告されている。 しかしながら、以下に詳述する本発明化合物はこれらの文献に記載されていない。 有用作物に対して使用される除草剤は、土壌又は茎葉に施用し、低薬量で十分な 除草効果を示し、しかも作物・雑草間に高い選択性を発揮する薬剤であることが望 まれる。これらの点で、当該公報に記載の化合物は必ずしも満足すべきものとは言 い難い。

発明の開示

本発明者らはこの様な状況に鑑み、各種化合物の除草効果と作物・雑草間の選択 20 性を検討した結果、新規なイソオキサゾリン誘導体が、優れた除草効果と作物・雑草間の選択性を有することを見いだし、本発明を完成するに至った。

即ち、本発明は

(1) 一般式 [I] を有するイソオキサプリン誘導体又はその薬理上許容される塩:

$$R^{1} \xrightarrow{\begin{array}{c} R^{2} \\ O \end{array}} R^{4} \qquad R^{6} \qquad \qquad [I]$$

式中、

15

20

R¹及びR²は、同一又は異なって、水素原子、C1~C10アルキル基、C3~C8 シクロアルキル基又はC3~C8シクロアルキルC1~C3アルキル基を示すか、或い はR¹とR²とが一緒になって、これらの結合した炭素原子と共に形成したC3~C7 のスピロ環を示し、

 R^3 及び R^4 は、同一又は異なって、水素原子、 $C1\sim C10$ アルキル基又は $C3\sim C8$ シクロアルキル基を示すか、或いは R^3 と R^4 とが一緒になって、これらの結合した 炭素原子と共に形成した $C3\sim C7$ のスピロ環を示し、更に R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は これらの結合した炭素原子と共に $5\sim 8$ 員環を形成することもでき、

R⁵及びR⁶は、同一又は相異なって、水素原子又はC1~C10アルキル基を示し、 Yは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子より選択される1以上の任意のヘテロ原子 を有する5~6員の芳香族ヘテロ環基又は芳香族ヘテロ縮合環基を示し、これらの ヘテロ環基は置換基群αより選択される、0~6個の同一又は相異なる基で置換さ れていてもよく、又、隣接したアルキル基同士、アルコキシ基同士、アルキル基と アルコキシ基、アルキル基とアルキルチオ基、アルキル基とアルキルスルホニル基、 アルキル基とモノアルキルアミノ基又はアルキル基とジアルキルアミノ基が2個 結合して1~4個のハロゲン原子で置換されてもよい5~8員環を形成されてい てもよく、又、これらのヘテロ環基のヘテロ原子が窒素原子の時は酸化されてNー オキシドになってもよく、

nは0~2の整数を示す。

「置換基群α」

水酸基、チオール基、ハロゲン原子、C1~C10アルキル基、置換基群βより選 択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル 基、C3~C8シクロアルキル基、C1~C10アルコキシ基、置換基群γより選択さ れる任意の基でモノ置換されたC1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロアルコキシ 5 基、C3~C8シクロアルキルオキシ基、C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキル オキシ基、C1~C10アルキルチオ基、置換基群ッより選択される任意の基でモノ 置換されたC1~C10アルキルチオ基、C1~C4ハロアルキルチオ基、C2~C6ア ルケニル基、C2~C6アルケニルオキシ基、C2~C6アルキニル基、C2~C6アル キニルオキシ基、C1~C10アルキルスルフィニル基、置換基群γより選択される 10 任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルスルフィニル基、C1~C10アルキル スルホニル基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10ア ルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルフィニル基、置換基群γより選択 される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルスルホニルオキシ基、C1~C 4ハロアルキルスルホニル基、C1~C10アルキルスルホニルオキシ基、C1~C4 15 ハロアルキルスルホニルオキシ基、置換されていてもよいフェニル基、置換されて いてもよいフェノキシ基、置換されていてもよいフェニルチオ基、置換されていて もよい芳香族へテロ環基、置換されていてもよい芳香族へテロ環オキシ基、置換さ れていてもよい芳香族へテロ環チオ基、置換されていてもよいフェニルスルフィニ ル基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族 20 ヘテロ環スルホニル基、置換されていてもよいフェニルスルホニルオキシ基、アシ ル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボ ニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、カルボキシル基、C1~C10アルコ キシカルボニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボニル基、置換され ていてもよいフェノキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基(該基の窒素原 25

子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていてもよいフェニル 基で置換されていてもよい。)、C1~C6アシルオキシ基、C1~C4ハロアルキル カルボニルオキシ基、置換されていてもよいベンジルカルボニルオキシ基、置換さ れていてもよいベンゾイルオキシ基、ニトロ基、アミノ基(該基の窒素原子は同一 又は異なって、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、C1~C 6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジル カルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキルスルホニ ル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホ ニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよ

「置換基群β」

10 W.)

20

25

水酸基、C3~C8シクロアルキル基(該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換 されてもよい)、C1~C10アルコキシ基、C1~C10アルキルチオ基、C1~C10 アルキルスルホニル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、C2~C6ハロアルケ 15 ニル基、アミノ基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基、 C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C10アルキルスル ホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基で置換されていてもよい)、カルバ モイル基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基で置換され ていてもよい)、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~ C10アルコキシイミノ基、シアノ基、置換されていてもよいフェニル基、置換され ていてもよいフェノキシ基

「置換基群ッ」

C1~C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換さ れていてもよい芳香族へテロ環基、シアノ基、カルバモイル基(該基の窒素原子は 同一又は異なって、C1~C10アルキル基で置換されていてもよい。)

(2)0~6個の同一又は相異なる基で置換されていてもよいヘテロ環上の置換基 群 α が、水酸基、ハロゲン原子、C1 \sim C10アルキル基、置換基群 β より選択され る任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C3 ~C8シクロアルキル基、C1~C10アルコキシ基、置換基群γより選択される任意 の基でモノ置換されたC1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロアルコキシ基、C3 ~C8シクロアルキルオキシ基、C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ 基、C1~C10アルキルチオ基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換さ れたC1~C10アルキルチオ基、C1~C4ハロアルキルチオ基、C2~C6アルケニ ル基、C2~C6アルケニルオキシ基、C2~C6アルキニル基、C2~C6アルキニル オキシ基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、 10 置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、置換され ていてもよいフェニルチオ基、置換されていてもよい芳香族へテロ環基、置換され ていてもよい芳香族へテロ環オキシ基、置換されていてもよい芳香族へテロ環チオ 基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族へ テロ環スルホニル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置 15 換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベングイル基、 カルボキシル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基 (該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていて もよいフェニル基で置換されていてもよい。)、ニトロ基、アミノ基(該基の窒素 原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル 20 基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよ いベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキ ルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベン ジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基で置換されて いてもよい。) であるか、或いは隣接したアルキル基同士、アルコキシ基同士、ア 25

ルキル基とアルコキシ基、アルキル基とアルキルチオ基、アルキル基とアルキルスルホニル基、アルキル基とモノアルキルアミノ基又はアルキル基とジアルキルアミノ基が2個結合して1~4個のハロゲン原子で置換されてもよい5~8員環を形成されていてもよい(1)に記載のイソオキサゾリン誘導体。

- 5 (3)0~6個の同一又は相異なる基で置換されていてもよいヘテロ環上の置換基群αが、ハロゲン原子、C1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C1~C 10アルコキシC1~C3アルキル基、C3~C8シクロアルキル基(該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されてもよい)、C1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロアルコキシ基、C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ基、置換されていてもよいフェノキシ基、C1~C10アルキルチオ基、C1~C10アルキルスルホニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なってC1~C10アルキル基で置換されていてもよい)である(2)に記載のイソオキサゾリン誘導体。
- 15 (4) R¹及びR²が、同一又は異なってメチル基もしくはエチル基、R³、R⁴、R⁵ 及びR⁵が水素原子である(1)、(2) 又は(3) のいずれかに記載のイソオキ サゾリン誘導体。
 - (5) Yが、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子より選択される任意のヘテロ原子を有する5員環又は6員環の芳香族ヘテロ環基である(1)、(2)、(3)又は(4)のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体。
 - (6) Yが、チエニル基、ピラゾリル基、イソキサゾリル基、イソチアゾリル基、 ピリジル基又はピリミジニル基である(5)に記載のイソオキサゾリン誘導体。
- (7) Yが、チオフェン-3ーイル基、ピラゾールー4ーイル基、ピラゾールー5
 ーイル基、イソオキサゾールー4ーイル基、イソチアゾールー4ーイル基、ピリジ
 25 ン-3ーイル基又はピリミジン-5ーイル基である(6)に記載のイソオキサゾリ

ン誘導体。

- (8) Yが、チオアェンー 3 ーイル基で、置換基群 α がチオフェン環の 2 及び 4 位 に置換した (7) に記載のイソオキサゾリン誘導体。
- (9)Υが、ピラゾールー4ーイル基で、置換基群αがピラゾール環の3及び5位 に、更に1位に水素原子、C1~C10アルキル基、置換基群βより選択される任意 Б の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C3~C8 シクロアルキル基、C2~C6アルケニル基、C2~C6アルキニル基、C1~C10ア ルキルスルフィニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、置換基群γより選択さ れる任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロア ルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳 10 香族へテロ環基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていても よい芳香族へテロ環スルホニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、 置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、 C1~C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボ ニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、カルバモイル基(該基の 15 窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていてもよいフ エニル基で置換されていてもよい)、アミノ基(該基の窒素原子は同一又は異なっ て、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、アシル基、C1~C 4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換 されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロ 20 アルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換され ていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい)が置換した(7)に 記載のイソオキサプリン誘導体。
- $(1\ 0)\ Y$ が、ピラゾール-5ーイル基で、置換基群 α がピラゾール環の4位に、 25 更に1位に水素原子、 $C1\sim C10$ アルキル基、置換基群 β より選択される任意の基

でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C3~C8シク ロアルキル基、C2~C6アルケニル基、C2~C6アルキニル基、C1~C10アルキ ルスルフィニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、置換基群ッより選択される 任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキ ルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族 ヘテロ環基、 置換されていてもよいフェニルスルホニル基、 置換されていてもよい 芳香族へテロ環スルホニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置 換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、 C1~C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボ ニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、カルバモイル基(該基の 10 窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていてもよいフ ェニル基で置換されていてもよい)、アミノ基(該基の窒素原子は同一又は異なっ て、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、アシル基、C1~C 4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換 されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロ 15 アルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換され ていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい)が必ず置換した(7) に記載のイソオキサゾリン誘導体。

- (11) Yが、イソオキサゾールー4ーイル基で、置換基群 α がイソオキサゾール 20 環の3位及び5位に置換した(7)記載のイソオキサゾリン誘導体。
 - (12) Yが、イソチアゾールー4ーイル基で、置換基群αがイソチアゾール環の 3位及び5位に置換した(7)記載のイソオキサゾリン誘導体。
 - (13) Yが、ピリジン-3 ーイル基で、置換基群 α がピリジン環の 2 位及び 4 位に置換した (7) 記載のイソオキサゾリン誘導体。
- 25 (14) Υが、ピリミジン-5-イル基で、置換基群αがピリミジン環の4位及び

25

6位に置換した(7)記載のイソオキサゾリン誘導体。

- (15) nが2である(1)~(14)のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体。
- (16) nが1である(1)~(14)のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体。
- (17) nが0である(1)~(14)のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体。
- (18) (1) \sim (17) のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体又は薬理上 許容される塩を有効成分として含有する除草剤。
- 10 尚、本明細書において、用いられる用語の定義を以下に示す。

C1~C10等の表記は、この場合ではこれに続く置換基の炭素数が、1~10で あることを示している。

ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を示す。

C1~C10アルキル基とは、特に限定しない限り、炭素数が1~10の直鎖又は 分岐鎖状のアルキル基を示し、例えばメチル基、エチル基、nープロピル基、イソ プロピル基、nープチル基、イソプチル基、secープチル基、tertープチル基、nーペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、nーヘキシル基、イソヘキシル 基、3,3-ジメチルプチル基、ヘプチル基、又はオクチル基等を挙げることができる。

20 C3~C8シクロアルキル基とは、炭素数が3~8のシクロアルキル基を示し、例 えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、又はシクロヘキシル 基等を挙げることができる。

C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキル基(該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されてもよい)とは、特に限定しない限り、同一又は異なって、ハロゲン原子1~4又はC1~C3アルキル基で置換されてもよいC3~C8シクロアルキル

基により置換されたC1~C3アルキル基を示し、例えばシクロプロピルメチル基、1ーシクロプロピルエチル基、2ーシクロプロピルエチル基、1ーシクロプロピルプロピルプロピルズロピル基、3ーシクロプロピルプロピル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロペキシルメチル基2ークロロシクロプロピルメチル基、2ーフルオロシクロプロピルメチル基、2・2ージフルオロシクロプロピルメチル基、2・メチルシクロプロピルメチル基、2・2ージメチルシクロプロピルメチル基、又は2ーメチルシクロプロピルエチル基等を挙げることができる。

C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキル基とは、炭素数が3~8のシクロアル キル基により置換された炭素数1~3のアルキル基を示し、例えばシクロプロピルメチル基、1ーシクロプロピルエチル基、2ーシクロプロピルエチル基、1ーシクロプロピルプロピル基、2ーシクロプロピルプロピルプロピルプロピル基、3ーシクロプロピルプロピルプロピル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、又はシクロヘキシルメチル基等を挙げることができる。

- 15 C1~C4ハロアルキル基とは、特に限定しない限り、同一又は異なって、ハロゲン原子1~9で置換されている炭素数が1~4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基を示し、例えばフルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2,2-ジフルオロエチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、又はペンタフルオロエチル基等を挙げることができる。
- 20 C2~C6アルケニル基とは、炭素数が2~6の直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を示し、例えばエテニル基、1ープロペニル基、2ープロペニル基、イソプロペニル基、1ープテニル基、2ープテニル基、3ープテニル基、又は2ーペンテニル基等を挙げることができる。

C2~C6アルキニル基とは、炭素数が2~6の直鎖又は分岐鎖のアルキニル基を 25 示し、例えばエチニル基、2-プロピニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2

10

ープチニル基、3ープチニル基、又は2-メチルー3ープチニル基等を挙げることができる。

C2~C6ハロアルケニル基とは、特に限定しない限り、同一又は異なって、ハロゲン原子1~4で置換されている炭素数が2~6の直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を示し、例えば3-クロロー2ープロペニル基、又は2-クロロー2-プロペニル基等を挙げることができる。

C1~C10アルコキシ基とは、アルキル部分が上記の意味である(アルキル) - O-基を示し、例えばメトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、イソプロポキシ基、tert-プトキシ基、n-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、又はイソプトキシ基等を挙げることができる。

C1~C4ハロアルコキシ基とは、ハロアルキル部分が上記の意味である (ハロアルキル) - O - 基を示し、例えばジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2,2-ジフルオロエトキシ基等を挙げることができる。

15 C3~C8シクロアルキルオキシ基とは、シクロアルキル部分が上記の意味である (シクロアルキル) -O-基を示し、例えばシクロプロピルオキシ基、シクロプチ ルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、又はシクロヘキシルオキシ基等を挙げるこ とができる。

C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ基とは、シクロアルキルアルキ 20 ル部分が上記の意味である (シクロアルキルアルキル) -O-基を示し、例えばシ クロプロピルメトキシ基、1-シクロプロピルエトキシ基、2-シクロプロピルエトキシ基、1-シクロプロピルプロポキシ基、3-シクロプロピルプロポキシ基、シクロブチルメトキシ基、シクロプロピルプロポキシ基、シクロブチルメトキシ基、シクロペンチルメトキシ基、又はシクロヘキシルメトキシ基等を挙げることができる。

25 C2~C6アルケニルオキシ基及びC2~C6アルキニルオキシ基とは、アルケニル

WO 02/062770 PCT/JP02/01015

又はアルキニル部分が上記の意味である(アルケニル)-O-基、(アルキニル) -O-基を示し、例えば2-プロペニルオキシ基、又は2-プロピニルオキシ基等 を挙げることができる。

C1~C10アルコキシイミノ基とは、アルコキシ部分が上記の意味である(アル コキシ)-N=基を示し、例えばメトキシイミノ基又はエトキシイミノ基等を挙げ ることができる。

C1~C10アルキルチオ基、C1~C10アルキルスルフィニル基及びC1~C10アルキルスルホニル基とは、アルキル部分が上記の意味である(アルキル)-S-基、(アルキル)-SO-基、(アルキル)-SO,-基を示し、例えばメチルチオ基、

10 エチルチオ基、n-プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、メチルスルフィニル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、n-プロピルスルホニル基、又はイソプロピルスルホニル基等を挙げることができる。

C1~C10アルキルスルホニルオキシ基とは、アルキルスルホニル部分が上記の 意味である(アルキルスルホニル)-O-基を示し、例えばメチルスルホニルオキ シ基又はエチルスルホニルオキシ基等を挙げることができる。

15

25

C1~C10アルコキシカルボニル基とは、アルコキシ部分が上記の意味である(アルコキシ) - CO-基を示し、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、又はイソプロポキシカルボニル基等を挙げることができる。

20 C1~C6アシル基とは、炭素数 1~6の直鎖又は分岐鎖状の脂肪族アシル基を示し、例えばホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、イソプロピオニル基、ブチリル基、又はピバロイル基等を挙げることができる。

C1~C10アシルオキシ基とは、アシル部分が上記の意味である(アシル)-O -基、を示し、例えばアセトキシ基、プロピオニルオキシ基、イソプロピオニルオキシ基、又はピバロイルオキシ基等を挙げることができる。

15

20

25

C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C4ハロアルキルチオ基及びC1~C4 ハロアルキルスルホニル基とは、ハロアルキル部分が上記の意味である(ハロアルキル) - CO-基、(ハロアルキル) - S-基、(ハロアルキル) - SO₂-基を示し、例えばクロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、ペンタフルオロプロピオニル基、ジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、クロロメチルスルホニル基、ジフルオロメチルスルホニル基、又はトリフルオロメチルスルホニル基等を挙げることができる。

C1~C4ハロアルキルカルボニルオキシ基及びC1~C4ハロアルキルスルホニルオキシ基とは、ハロアルキルカルボニル部分及びハロアルキルスルホニル部分が上記の意味である(ハロアルキルカルボニル)-O-基、(ハロアルキルスルホニル)-O-基を示し、例えばクロロアセチルオキシ基、トリフルオロアセチルオキシ基、クロロメチルスルホニルオキシ基、又はトリフルオロメチルスルホニルオキシ基等を挙げることができる。

(置換されていてもよい)フェニル基、(置換されていてもよい)芳香族へテロ環基、(置換されていてもよい)フェノキシ基、(置換されていてもよい)芳香族へテロ環オキシ基、(置換されていてもよい)フェニルチオ基、(置換されていてもよい)芳香族へテロ環チオ基、(置換されていてもよい)フェニルスルホニル基、(置換されていてもよい)フェニルスルホニル基、(置換されていてもよい)フェニルスルホニル基、(置換されていてもよい)ベンジルカルボニル基、(置換されていてもよい)ベンジルカルボニル基、(置換されていてもよい)ベンジルスルホニル基、(置換されていてもよい)ベンジルスルホニル基、(置換されていてもよい)ベンジイル基、(置換されていてもよい)ベンジルオキシカルボニル基又は(置換されていてもよい)フェノキシカルボニル基における「置換されていてもよい」とは、例えばハロゲン原子、C1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C1~C10アルコキシ基、C1~C

10アルキルチオ基、C1~C10アルキルスルホニル基、アシル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基で置換されていてもよい)、ニトロ基、又はアミノ基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、又はC1~C4ハロアルキルスルホニル基で置換されていてもよい)等で置換されていてもよいことを示す。

窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から任意に選択される1以上のヘテロ原子を有する5員から6員の芳香族ヘテロ環基とは、例えばヘテロ原子を1から3個有するフリル基、チエニル基、ピロリル基、ピラブリル基、イソキサブリル基、イソチアブリル基、オキサブリル基、チアブリル基、イミダブリル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジール基、トリアブリル基、オキサジアブリル基又はチアジアブリル基を挙げることができる。

芳香族へテロ縮合環基とは、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から任意に選択されるへテロ原子を1~3個有する基を示し、例えばベングフリル基、ベングチエニル基、インドリル基、ベングオキサゾリル基、ベングチアグリル基、ベングイミダグリル基、ベングイソキサグリル基、ベングイソチアグリル基、インダグリル基、キノリル基、インキノリル基、フサラジニル基、キノキサリニル基、キナゾリニル基、シンノリニル基又はベングトリアゾリル基を挙げることができる。

20 (置換されていてもよい) 芳香族ヘテロ環基、(置換されていてもよい) 芳香族 ヘテロ環オキシ基、(置換されていてもよい) 芳香族ヘテロ環チオ基又は(置換されていてもよい) 芳香族ヘテロ環スルホニル基の芳香族ヘテロ環とは、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から任意に選択されるヘテロ原子を1~3個有する5~6 員の基を示し、例えばフリル基、チエニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イソキ サプリル基、イソチアブリル基、オキサブリル基、チアブリル基、イミダブリル基、

ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基又はチアジアゾリル基を挙げることができる。 薬理上許容される塩とは、一般式 [I] を有する化合物において、水酸基、カルボキシル基又はアミノ基等がその構造中に存在する場合に、これらと金属もしくは 有機塩基との塩又は鉱酸もしくは有機酸との塩であり、金属としてはナトリウム又はカリウム等のアルカリ金属或いはマグネシウム又はカルシウム等のアルカリ土 類金属を挙げることができ、有機塩基としてはトリエチルアミン又はジイソプロピルアミン等を挙げることができ、鉱酸としては塩酸又は硫酸等を挙げることができ、有機酸としては酢酸、メタンスルホン酸又はpートルエンスルホン酸等を挙げることができる。

上記した一般式 [I] の中で好ましくは、R¹及びR²が、同一又は異なってメチル 基又はエチル基であり、

R³、R⁴、R⁵及びR⁵が水素原子であり、

n が2であり、

- 15 Yがチオフェンー3ーイル基(ここで該基の2位及び4位は、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なってアルキル基で置換されていてもよい)が置換する。)、
- 20 ピラゾールー4ーイル基(ここで該基の3位及び5位は、ハロゲン原子、アルキル 基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、 ハロアルコキシ基、シクロアルキルアルキルオキシ基、置換されていてもよいフェ ノキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカル ボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基(該基の窒素原 25 子は同一又は異なってアルキル基で置換されていてもよい)が、更に1位に水素原

子、アルキル基、置換基群βより選択される任意の基でモノ置換されたアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルキルスルホニル基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたアルキルスルホニル基、のロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい方香族へテロ環基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい方香族へテロ環スルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルオニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボニル基、置換されていてもよいブェノキシカルボニル基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なって、アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい)が置換する。)、

ピラゾールー5ーイル基(ここで該基の4位はハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、ハロアルコキシ基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基(該基の窒素 原子は同一又は異なってアルキル基で置換されていてもよい)が、更に1位は水素原子、アルキル基、置換基群βより選択される任意の基でモノ置換されたアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基又は置換されていてもよいフェニル基が置換する。)、

イソオキサゾールー4ーイル基(該基の3位及び5位は、ハロゲン原子、アルキル 20 基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なってアルキル基で置換されていてもよい)が置換する。)、イソチアゾールー4ーイル基(該基の3位及び5位は、ハロゲン原子、アルキル基、

25 ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、ハロ

アルコキシ基、置換されていてもよいフェノキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なってアルキル基で置換されていてもよい)が置換する。)、

5 ピリジン-3-イル基(該基の2位及び4位は、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なってアルキル基で置換されていてもよい)が置換する。)、或い

10 は、

15

ピリミジン-5-イル基(該基の4位および6位は、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なってアルキル基で置換されていてもよい)が置換する。)である。

発明を実施するための最良の形態

次に、一般式 [I] を有する本発明化合物の代表的な化合物例を表1~表10に 20 記載する。しかしながら、本発明化合物はこれらに限定されるものではない。

本明細書における表中の次の表記は下記の通りそれぞれ該当する基を表す。

Me :メチル基

E t : エチル基、

Pァ : n - プロピル基

Pァーi :イソプロピル基

Pr-c:シクロプロピル基

B u

: n ープチル基

25 Bu-i:iso-ブチル基

Bu-s

: secープチル基

WO 02/062770 PCT/JP02/01015

18

Bu-t:tert-ブチル基 Bu-c :シクロブチル基

Pen:n-ペンチル基 Pen-c:シクロペンチル基

Hex:n-ヘキシル基 Hex-c:シクロヘキシル基

Ph:フェニル基

5 又、例えば(4-C1) Phの表記は4-クロロフェニル基、3-Hexは3-ヘキシル基を表す。

尚、本発明化合物は置換基として水酸基を含む場合、ケトーエノール互変異性体 を有する化合物があるが、何れの異性体もその混合物も本発明化合物に含まれる。

表1

	.	-(CH ₂) ₃ -	Н	H	2	Н	Н	s	lcı	lc1	C1	
	1	-(CH ₂) ₄ -	H	H	2		H	s	Cl	Cl	Cl	
	1	-(CH ₂) ₅ -	H	H	2		H	s	Cl	Cl	CI	
	H	-(CH		H	2		H	S	Cl	Cl	CI	
	H	-(CH		H	2		H	s	Cl	CI	ci	
	H	-(CH		H	2	i	H	s	Cl	Cl	Ci	
	H	-(CH		Н	2		H	S	C1	Ci	CI	
	Me	Me	H	H	1		H	S	Me	Н	H	
	Me	Me	H	H	1	H	H	s	CI	Me	H	
	Me	Me	H	H	1	H	н	S	H	H	Me	
	Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cı	H	H	
	Me	Me	H	H	1	H	H	S	H	н	Cı	
	Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl	
	Me	Me	H	H	1	H	H	S	ОМе	H	H	
	Me	Me	H	H	1	H	H	S	OEt	H	H	
	Me	Me	H	H	1	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
	Me	Me	H	H	1	H	H	S	OCH ₂ Ph	H	H	
	Ме	Me	H	H	1	H	H	0	H	H	H	ı
	Me	Me	H	H	1	H	H	0	H	H	C(=O)OMe	
	Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	I .	H	Me	1
	Me	Me	H	H	1	H	H	NMe		C(=O)OMe	CH ₂ C(=O)OMe	ı
	Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	1	C(=O)OEt	CH ₂ C(=O)OEt	İ
	Me	Me	H	H	1	H	H	NMe		Me	Me	
	Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	1	H	H	1
	Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OEt	H	H	۱
	Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	1	H	H	
	H	H	H	H	1	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
	Me	H	H	H	1	H	H	S	OCHF ₂	H	H	I
	Me	H	Ме	H	1	H	H	S	OCHF ₂	H	H	l
	Me Me	Me Me	H	H	1 1	Me	H	S	OCHF2	H	H	l
	Me	Me	H	H	1	Et Pr-i	Н	s s	OCHF ₂	H H	H	l
	Me	Me	H	H	1	Me		S		H	H H	ĺ
	Me	Et	H	H	1	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
	Et	Et	H	H	1	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
	Me	Pr-i	H	H	1	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
	Me	Pr	H	H	1	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
i	Me	Pr-c	H	H	1	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
	Me	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	S	OCHF ₂	H	н Н	
		(CH ₂) ₂ -	H	H	1	H	H	S	Cl			
		$(CH_2)_3$ -	H	H	1	Н	H	S		Cl	C1	
		(CH ₂) ₄ -	H	H		H	н		Cl	Cl	C1	
I	,	O112/4	11	11	1	п	п	Ö	Cl	Cl	C1	

-	(CH ₂) ₅ -	н	н	1	н	н	s	Cl	Cı	CI
H	-(CH ₂)3-	н	1	H	н	s	CI	Cl	Cl
H	-(CH ₂		H	1	н	Н	s	Cl	Cı	Cl
H	-(CH ₂		H	1	H	н	s	Cl	Cı	CI
H	-(CH ₂		H	1	H	H	s	Cl	CI	CI
Me	Me	H	н	lo	н	H	s	Me	H	H
Me	Me	н	н	0	н	н	s	Cı	Me	H
Me	Me	н	Н	0	H	H	s	H	н	Me
Me	Me	H	н	0	н	H	s	Cl	н	H
Me	Me	H	н	0	H	H	s	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	Н	н	s	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	н	0	H	H	s	OMe	H	H
Me	Me	\mathbf{H}	H	0	H.	H	S	OEt	H	H
Me	Me	H	н	0	H	H	S	OCHF2	H	H
Me	Me	H	н	0	H	H	ន	OCH ₂ Ph	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	0	H	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	0	H	H	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Me	H	Me
Ме	Me	H	H	0	H	H	NMe	1	C(=O)OMe	CH ₂ C(=O)OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe		C(=O)OEt	CH ₂ C(=O)OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	4	Me	Me
Ме	Me	H	H	0	H	H	NPh	ОМе	H	Ħ
Me	Me	H	H	0	H	H	ı	OEt	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OCHF ₂	H	H
H	H	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	H	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	H	Me	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Me	H	H	0	Me	H	S	OCHF ₂	H	H
Ме	Me ·	H	H	0	Et	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Me	H	H	0	Pri	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Me	H	H	0	Me	Me	S	OCHF ₂	H	H
Me	Et	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Et	Et	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Pr•i	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Ме	Pr	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Ме	Pr-c	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me		H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	н	H
	$(CH_2)_2$ -	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	CI
	(CH ₂) ₈ -	H	H	0	H	H	S	Cl	CI	Cl
	(CH ₂)₄-	H	H	0	H	H	S	Cl	CI	Cl
	(CH ₂) ₅ -	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	C1
H	-(CH ₂)) ₈ -	H	0	H	H	S	Cl	CI	Cl

H	-(CH2)4-	H	0	H	H	s	CI	$\{c_1$	CI	1
H	-(CH ₂) ₅ -		H	0	H	H	S	Cl	C1	Cı	}
H	-(CH ₂)6-	H	0	H	H	S	Cl	Cı	CI	
Me	Et	H	H	2	H	H	S	H	H	H	
Me	Et	H	H	2	H	H	0	H	H	H]
Me	Et	H	H	2	H	H	NH	H	Н	H	

表 2

	R^{1} R^{2} R^{3} R^{4} R^{6} R^{26} R^{27} R^{5} R^{25}														
\mathbb{R}^{1}	R ²	\mathbb{R}^3	R4	n	R ⁵	\mathbb{R}^6	\mathbb{Z}^2	\mathbb{R}^{25}	$ m R^{26}$	\mathbb{R}^{27}					
Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	H					
Me	Me	H	H	2	H		S	H	OMe	H					
Me	Me	H	H	2	H	H	S	C1	H	CI					
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	CI	Cl					
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Me	H					
Me	Me	H	H	2	H	H	S	NHMe	Me	H					
Me	Me	H	H	2	H	H	S	$N(Me)_2$	Me	H					
Me	Me Me H H 2 H H S NHC(=O)Me Me H														
Me	Me Me H H 2 H H S NHC(=O)Ph Me H														
Me	Me	H	H	2	H	H	S	NHSO ₂ Me	Me	H					
Me	Me	H	H	2	н	н	s	NHSO ₂ Ph	Ме	н					
Me	Me	H	H	2	H		S	Me	Me	Me					
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)OMe	Me					
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)OEt	Me					
Me	Me	\mathbf{H}	H	2	H	H	S	Me	C(=O)OPh	Me					
Me	Me	H	H	2	H		S	Me	CN	Me					
Me	Me	H	$ \mathbf{H} $	2	H		S	Me	C(=O)NHMe	Me					
Me	Me	H	H	2	H		S	Me	C(=O)Me	Me					
Me	Me	H	H	2	H	H		Me	C(=O)Et	Me					
Me	Me	H	H	2	H	H		Me	C(=0)Pr-i	Me					
Me	Me	H	H	2	H			Me	C(=O)Pr	Me					
Me	Me	H	H	2	H	H		Me	C(=O)CF ₈	Me					
Me	Me	H	H	2	H	H		Me	C(=NOMe)Me	Me					
Me	Me	H	H	2	H	H		Ph	C(=O)Me	Me					
Me	Me	H	H	2	H	H	s	Ph	C(=NOMe)Me	Me					
Me	Me	H	H	2	H	H	s	CF ₃	OMe	н					
Ме	Мe	H	H	2	H	H	s	CF ₈	OEt	H					

_								•		
Me	Me	H	H	2	H	H	s	CF ₃	OPr-i	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₈	OPr-i	H
Me	Me	H	H	2	н	H	S	CF ₈	OCHF ₂	H
Me	Me	H	\mathbf{H}	2	H		S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	2	H		S	Cl	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H		S	Cl	C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H		S	C1	CN	CI
Me	Me	H	H	2	H	H		C1	C(=O)NHMe	C1 C1
Me	Me	H	H	2	H		S	C1	C(=O)N(Me) ₂	1
Me	Me	H	H	2	H	H	S	C1	C(=O)Me C(=O)Et	C1 C1
Me	Me Me	H	H	2 2	H	H	S S	C1 C1	C(=O)Et C(=O)Pr-i	CI
Me Me	Me	H	H	2	H	H	s	Ci	C(=O)Pr	Ci
Me	Me	H	H	2	H	H	s	Ci	C(=0)CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	s	CI	C(=NOMe)Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	o	H	H	H
Me	Me	H	H	2	H	H	o	Me	H	Cl
H	H	H	H	2	H	H	s	C1	Cl	C1
Me	H	\mathbf{H}	\mathbf{H}	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	H	Me	H	2	H	H	S	Cl	Cl	CI
Me	Me	H	H	2	Me		S	Cl	Cl Cl	Cl Cl
Me Me	Me Me	H	H H	2 2	Et Pr-i	,	s s	Cl Cl	Ci	C1
Me	Me Me	H	H	2	Me			Ci	ci	CI
Me	Et	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Et	Et	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr•i	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	CI
Me	Pr	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	CI
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	CH ₂ Pr-	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	CI
-((CH ₂) ₂ -	H	H	2	H	H	s	Cl	Cl	Cı
i	CH ₂) ₈ -	н	H	2	Н	н	s	Cl	cı	Cı
	CH ₂) ₄ -	H	н	2	H	н	s	Cl	lc1	Cl
l	CH ₂) ₅ -	н	H	2	H	Н	s	Cl	Cl	CI
H	-(CH		н	2	Н	н	s	Cl	Cı	Cı
H	-(CH:		H	2	H	н		Cl	Cı	Cl
H	-(CH		H	2	H	н	s	Cl	Cl	Cl
H	-(CH		H	2	H	н	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	H .	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	s	H	ОМе	H
Me	Me	H	H	1	H	H		Cl	H	CI
Me	Me	H	H	•	H		S	CI	C1	Cl
Me	Me	ļΗ	H	1	H	H	JS	C1	Me	H

	٥									
Me	Me	H	H	1	H	H	s	NHMe	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	s	N(Me) ₂	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	NHC(=O)Me	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	NHC(=O)Ph	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	NHSO₂Me	Me	H
Me	Me	H	Н	1	H	H	s	NHSO ₂ Ph	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	s	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H		S	Me	C(=O)OMe	Me
Me	Me	H	H	1	H		S	Me	C(=O)OEt	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)OPh	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	CN	Me
Me Me	Me Me	H	H	1	H	H	S	Me Me	C(=O)NHMe C(=O)Me	Me
Me	Me	H	Н	1	H	H	S S	Me	C(=O)Me C(=O)Et	Me Me
Me	Me	H	H	ĺ	H	H	s	Me	C(=0)Pr-i	Me
Me	Me	H	H	î	H		S	Me	C(=0)Pr	Me
Me	Me	H	Н	1	H	H	s	Me	C(=O)CF ₈	Me
Me	Me	H	н	1	H	•	s	Me	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	H	ī	H		s	Ph	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	н	1	H	H		Ph	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	н	1	H	H	s	CF ₃	ОМе	H
Me	Me	H	H	1	H	Н	s	CF ₈	OEt	H
Ме	Me	H	н	1	H	H	S	CF ₃	OPr-i	н
Ме	Me	H	H	1	H	H	s	CF ₃	OPr-i	H
Me	Me	H	н	1	H	H	s	CF ₃	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H		Cl	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H		Cl	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H		CI	C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	CN CONTRA	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H		C1	C(=O)NHMe	C1
Me	Me	H	H	1	H	H	1	C1	C(=O)N(Me) ₂	C1
Me Me	Me Me	H	H	1	H H	H		C1 C1	C(=O)Me C(=O)Et	CI CI
Me	Me	H	H	1	H	H		C1	C(=0)Pr-i	CI
Me	Me	H	H		H	H		CI	C(=0)Pr	CI
Me	Me	H	H	1	H	H		CI	C(=O)CF ₈	CI
Me	Me	H	н	1	H	H		Cl	C(=NOMe)Me	CI
Me	Me	H	H	î	H	H		H	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H		Me	H	ci
H	H	H	H	1	H	H		Cl	Cl	CI
Me	H	H	Н	1	H	H		Cl	Cl	Cl
Me	H	Me	H	1	H	H		Cl	CI	Cl
Me	Me	H	H	1	Me			Cl	Cl	Cl
Me	Me		H	1	Et			Cl	Cl	C1
Me	Me	H	$ \mathbf{H} $	1	Pr-i	H	S	[C1	[C1	C1

Me	Me	H	H		Me			Cl	C1	Cl
Me	Et	H	$ \mathbf{H} $	1	H	\mathbf{H}	S	Cl	C1	Cl
Et	Et	H	H	1	H	H	S	CI	C1	Cl
Me	Pr-i	H	H	1	H	\mathbf{H}	S	Cl	Cl	Cl
Me	\mathbf{Pr}	H	H	1	H		S	Cl	C1	Cl
Me	Pr-c	H	H	1	\mathbf{H}	H	S	Cl	C1	Cl
Me	CH ₂ Pr-	H	H	1	H	H	s	Cı	Cı	Cl
-(0	CH ₂) ₂ -	H	H	1	H	H	s	Cı	C1	Cl
-(0	CH ₂) ₃ -	H	H	1	H	H	S	Cl	CI	Cı
-((CH ₂) ₄ -	H	H	1	H	H	S	Cı	Cl	CI
-((CH ₂) ₅ -	H	H	1	H	H	s	Cl	C1	Cl
H	-(CH ₂) ₃ -	H	1	H	H	S	Cl	C1	Cl
H	-(CH ₂)4-	H	1	H	H	S	Cl	CI	Cl
н	-(CH ₂) ₅ -	H	1	H	H	S	Cl	Cı	Cl
H	-(CH ₂)6-	H	1	H		S	Cl	CI	Cl
Me	Me	H	H	0	H		S	H	H	H
Me	Me	H	H	0	H	Η	S	H	OMe	H
Me	Me	H	H	0	H		S	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	0	H		S	Cl	CI	Cl
Me	Me	H	H	0	H		S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	•	S	NHMe	Me	H
Me	Me	H	H	0	H		S	N(Me) ₂	Me	H
Me	Me	H	H	0	H		S	NHC(=O)Me	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	1	S	NHC(=O)Ph	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	ı	S	NHSO ₂ Me	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	1	S	NHSO ₂ Ph	Me	H
Me	Me	H	H	0	H		S	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H		S	Me	C(=O)OMe	Me
Me	Me	H	H	0	H		s	Me	C(=O)OEt	Me
Me	Me	H	H	0	H		S	Me	C(=O)OPh CN	Me Me
Me	Me	H	H	0	H		s s	Me Me	C(=O)NHMe	Me .
Me	Me	H	H	0	H		S	Me	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	0	H		S	Me	C(=O)Et	Me
Me Me	Me Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)Pr-i	Me
Me		H	표	0	H	H		Me	C(=O)Pr	Me
Me	Me Me	H	H	0	н	1	s	Me	C(=O)CF ₃	Me
		H		0	H	i .	s	Me	C(=NOMe)Me	Me
Me Me	Me Me	H	H	0	H		S	Ph	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	0	H		S	Ph	C(=NOMe)Me	Me
1	1		l l	ı		1	s	CF ₈	OMe	H
Me	Me	H	H	0	H		1		OEt	H
Me	Me	H	H	0	H	H		CF ₃	i	· F
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	OPr-i	H

Me											
Me Me H H O H H S Cl Me Me Me Me Me H H O H H S Cl Cl Cl=O)OMe Cl Me Me H H O H H S Cl Cl=O)OMe Cl Me Me H H O H H S Cl Cl=O)N(Me)2 Cl Me Me H H O H H S Cl Cl=O)N(Me)2 Cl Me Me H H O H H S Cl Cl=O)Me Cl Cl=O)Me Cl Cl=O)Me Cl Cl=O)Pri Cl Cl <t< td=""><td>Me</td><td>Me</td><td>H</td><td>H</td><td>0</td><td>H</td><td>H</td><td>s</td><td>CF_3</td><td>OPr-i</td><td>H</td></t<>	Me	Me	H	H	0	H	H	s	CF_3	OPr-i	H
Me	Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₈	OCHF ₂	H
Me Me H H O H H S Cl C(=0)OMe Cl Me Me H H O H H S Cl C(=0)OMe Cl Me Me H H O H H S Cl C(=0)N(Me) ₂ Cl Me Me H H O H H S Cl C(=0)Me Cl Me Me H H O H H S Cl C(=0)Me Cl Me Me H H O H H S Cl C(=0)Pr Cl Me Me H H O H H S Cl C(=0)Pr Cl Me Me H H O H H S Cl Cl C(=0)Pr Cl Me Me H H O	Me	Me	H	H	0	H	H	S	CI	Me	н
Me Me H H O H H S Cl CN Cl		Me	H		0	H	H	S	Cl	Me	Me
Me											
Me Me H H O H H S Cl C(=O)N(Me) ₂ Cl Me Me H H O H H S Cl C(=O)N(Me) ₂ Cl Me Me H H O H H S Cl C(=O)Me Cl Me Me H H O H H S Cl C(=O)Pr Cl Me Me H H O H H S Cl C(=O)CF ₈ Cl Me Me H H O H H S Cl C(=O)CF ₈ Cl Me Me H H O H H S Cl C(=O)CF ₈ Cl Me Me H H O H H S Cl Cl Cl Cl Me H H O H											
Me Me H H 0 H H S Cl C(=O)Me Cl Me Me H H 0 H H S Cl C(=O)Et Cl Me Me H H 0 H H S Cl C(=O)Prical Cl Me Me H H 0 H H S Cl C(=O)Prical Cl Me Me H H 0 H H S Cl C(=O)CFs Cl Me Me H H 0 H H S Cl C(=O)CFs Cl Me Me H H 0 H H S Cl Cl C(=O)CFs Cl Me Me H H 0 H H S Cl Cl Cl Cl Me H H H		1	1		ı		t t			1	Cl
Me Me H H O H H S Cl C(=O)Et Cl Me Me H H O H H S Cl C(=O)Pri Cl Me Me H H O H H S Cl C(=O)Pri Cl Me Me H H O H H S Cl C(=O)Pri Cl Me Me H H O H H S Cl C(=O)Pri Cl Me Me H H O H H S Cl Cl Cl Cl Me Me H H O H H S Cl	l .	1	1	1	ı	1			1		Cl
Me Me H H O H H S Cl C(=O)Pri Cl Me Me H H O H H S Cl C(=O)Pri Cl Me Me H H O H H S Cl C(=O)Pri Cl Me Me H H O H H S Cl C(=O)Pri Cl Me Me H H O H H S Cl Cl Cl Cl Me Me H H O H H O Me H	1								I I		
Me		1	1				H	S			
Me Me H H O H H S Cl C(=O)CFs Cl Me Me H H O H H S Cl C(=NOMe)Me Cl Me Me H H O H H O H<		Me Me				1					
Me Me H H O H H S CI C(=NOMe)Me CI Me Me H H O H		1	1		ı	1			1		
Me Me H H O H H O H		I				1		1		1	3
Me Me H H O H H O Me H CI	1				_						
H H H H H O H H S CI		1									
Me H H H 0 H H S CI			4		i e						
Me H Me H O H H S Cl											
Me Me H H 0 Me H S Cl											
Me Me H H 0 Et H S Cl								0			
Me Me H H 0 Pri H S Cl											
Me Me H H 0 Me Me S Cl					-						
Me Et H H 0 H H S Cl											
Et Et H H 0 H H S Cl											
Me Me Me Pr i Me H H H O H H S CI CI CI CI CI CI CI CI CI CI CI CI CI CI C											
Me Me Pr Pr-c Me H H O H H S Cl <	Me	Pr-i	H		0		H	S			
$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$		Pr			0		H	S			Cl
Me	Me		H	H	0	H	H	S	C1	Cl	Cl
$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	Me	l	H	н	0	H	н	s	Cı	CI	Cl
$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	-(($ _{\mathbf{H}} $	0	$_{\rm H}$	н	s	lc1	lc1	lc1
$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	1			1 1	-	1 I	· '	ŀ	1	1	1
$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	1		1	l i		1 1			1	1	
H -(CH ₂) ₅ - H 0 H H S Cl Cl Cl Cl H -(CH ₂) ₅ - H 0 H H S Cl Cl Cl Cl	-(0			н	0	$ _{\rm H} $			J	1	i
H -(CH ₂) ₄ - H 0 H H S Cl Cl Cl Cl				н	0	$ _{\rm H} $			1	ſ	1
H -(CH ₂) ₅ - H 0 H H S C1 C1 C1	1			i		1 1			ł	1 .	1
	H	1		н	0	$ _{\rm H} $		ì	1		I i
					0	H			Cl	Cl	Cl

表3

	$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$													
\mathbb{R}^1	R ²	R ⁸	\mathbb{R}^4	n	\mathbb{R}^5	R ⁶	R ²⁹	R ²⁸	R ³⁰					
Me	Me	H	н	2	H	H	CI	н	Cl					
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF2	н	C1 .					
Ме	Me	H	H	2	H	H	OCHF2	H	OCHF2					
Me	Me	H	н	2	H	H	Me	H	C1					
Me	Me	H	н	2	H	н	Me	H	OCHF2					
Me	Me	H	н	2	H	H	CHF2	H	CI					
Ме	Me	H	н	2	H	н	CHF2	H	OCHF ₂					
Me	Me	н	H	2	н	H	CF ₃	н	F					
Ме	Me	H	H	2	н	H	CF ₈	H	C1					
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₈	н	ОМе					
Me	Me	H	H	2	н	н	CF ₃	н	OEt					
Me	Me	H	H	2	н	H	CF ₈	н	OCHF2					
Ме	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	H	CN					
Me	Me	н	H	2	H	H	CF ₃	н	Me					
Me	Me	H	H	2	H	н	H	Me	Cl					
Me	Me	H	н	2	H	H	Ме	Me	Me					
Me	Me	H	н	2	H	н	Me	Me	F					
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	Me					
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	CI					
Me	Me	H	H	2	H	H	C1	Me	Me					
Me	Me	H	H	2	H	н	Me	Me .	OMe					
Me	Me	H	H	2	н	н	ОМе	Me	Me					
Me	Me	H	H	2	H	н	Me	Me	OCHF2					
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Me	Me					
Me	Me	н	H	2	H	н	Me	Me	CN					
Me	Me	н	H	2	н	H	CN	Me	Me					
Me	Me	н	H	2	н	H	Et	Me	F					
Me	Me	H	H	2	н	н	F	Me	Et					
Me	Me	H	H	2	H	н	Et	Me	C1					

Me Me	н	н	2	н	н	CI	Me	Et .
Me Me	H	н	2	H	H	Et	Me	ОМе
Ме Ме	н	H	2	H	H	ОМе	Me	Et
Me Me	H	н	2	H	H	Et	Me	OCHF ₂
Me Me	н	н	2	H	H	OCHF2	Me	Et
Ме Ме	н	н	2	H	H	Et	Ме	CN
Me Me	н	н	2	н	н	CN	Me	Et
Ме Ме	н	H	2	H	H	Pr-i	Me	F
Ме Ме	H	н	2	H	H	F	Ме	Pr-i
Me Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Me	CI
Me Me	H	H	2	H	H	cı	Ме	Pr-i
Me Me	H	H	2	H	Н	Pr-i	Ме	ОМе
Me Me	H	н	2	H	H	OMe	Ме	Pr-i
Ме Ме	H	H	2	H	H	Pr-i	Me	OCHF2
Me Me	н	H	2	H	H	OCHF2	Mė	Pr-i
Me Me	H	н	2	H	H	Pr-i	Me	CN
Ме Ме	н	H	2	H	H	CN	Ме	Pr-i
Ме Ме	H	H	2	H	H	Bu-t	Me	F
Me Me	H	H	2	H	H	F	Ме	Bu-t
Me Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Ме	CI
Me Me	H	H	2	H	H	Cl	Ме	Bu-t
Me Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Me	ОМе
Me Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	Bu-t
Me Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Me	OCHF ₂
Me Me	H	H	2	H	H	OCHF2	Me	Bu-t
Me Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Me	CN
Ме Ме	H	H	2	H	H	CN	Me	Bu-t
Me Me	H	H	2	H	H	CH ₂ OMe	Ме	F
Me Me	H	H	2	H	H	F	Me .	CH₂OMe
Ме Ме	H	H	2	H	H	CH ₂ OMe	Me	CI
Me Me	H	H	2	H	H	Cı	Me	CH₂OMe
Me Me	H	H	2	H	H	CH ₂ OMe	Me	ОМе
Me Me	H	Н	2	H	H	OMe	Me	CH ₂ OMe
Me Me	H	H	2	H	H	СН₂ОМе	Me	OCHF ₂
Me Me	H	H	2	H	H	OCHF2	Me	CH₂OMe
МеМе	н	H	2	H	H	CH₂OMe	Ме	CN
Me Me	H	H	2	H	H	CN	Me	CH₂OMe
Me Me	H	н	2	H	H	CI	Me	cı

Me	Me	H	H	2	н	H	CHF ₂	Me.	Cı
Me	Me	H	H	2	н	н	Cl	Me	CHF ₂
Me	Ме	H	н	2	H	H	OCHF2	Me	H .
Me	Me	H	н	2	H	H	OCHF2	Me	F
Me	Me	H	H	2	н	H	F	Ме	OCHF2
Me	Me	H	н	2	н	H	OCHF2	Me	Cı
Ме	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me .	OCHF ₂
Ме	Me	H	н	2	н	H	OCHF2	Me	OMe
Me	Me	H	н	2	H	H	OMe	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	н	2	н	H	OCHF2	Me	OCHF2
Ме	Me	H	н	2	H	H	OCHF2	Ме	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Ме	OCHF ₂
Ме	Me	H	H	2	н	H	CF ₃	Me	H
Ме	Ме	H	Ħ	2	н	H	CF ₃	Me .	CI
Me	Me	H	H	2	H	H	Cı	Me	CF ₃
Ме	Me	H	н	2	H	H	CF ₈	Me	Br
Ме	Me	H	H	2	н	H	Br	Ме	CF ₃
Ме	Ме	H	н	2	H	H	CF ₃	Me	Ι
Ме	Me	H	H	2	H	H	I	Me	CF ₈
Ме	Ме	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	CF ₃
Ме	Me	H	H	2	н	H	CF ₈	Me	OH
Me	Me	H	H	2	H	H	OH	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	ОМе
Me	Ме	H	H	2	H	H	OMe	Me	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Me	CF ₈
ŀ	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	OPr-i
I	Ме	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OPr
Į .	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OBu-t
ļ	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OBu-s
1	Me	H	H	2	H	Н	CF ₈	Me	OBu-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	OBu
i .	Me	H	H	2	H	H	CF _a	Me	O(2-Pen)
1	Me	H	H	2	H	н	CF ₈	Me	O(3-Pen)
Me	Me	H	H	2	H	н	CF ₈	Me	OPen-n
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-Hex)
Ме	Me	н	H	2	Н	H	CF ₃	Ме	O(3-Hex)

Me	Me	н	H	2	н	н	CF3	Me	OHex-n
Me	Me	н	H	2	н	H	CF3	Ме	OPen-c
Me	Me	н	н	2	н	н	CF ₈	Ме	OHex-c
Me	Me	н	н	2	H	н	CF ₈	Me	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	H	2	н	H	CF ₃	Me	OCH2Bu-c
Me	Me	H.	н	2	H	H	CF ₃	Ме	OCH ₂ Pen-c
Me	Me	н	H	2	H	н	CF ₃	Ме	OCH ₂ Hex-c
Me	Me	H	н	2	H	н	CF ₃	Ме	OCH2CH=CH2
Me	Me	H	H	2	H	н	CF ₈	Me	OCH ₂ C≡CH
Me	Me	н	н	2	H	н	CF ₈	Ме	OCHF2
Me	Me	H'	H	2	H	н	OCHF2	Ме	CF ₃
Me	Me	н	H	2	H	н	CF ₃	Me	OCH2CHF2
Me	Me	H	H	2	H	н	OCH ₂ CHF ₂	Me	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	Ħ	CF ₃	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	Ħ	H	2	H	H	OCH₂CF ₈	Me	CF ₈
Me	Ме	H	H	2	н	H	CF3	Me	OCH₂CN
Me	Me	н	H	2	H	H	CF ₈	Ме	OCH ₂ C(=0)OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ме	OCH(Me)C(=O)OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ме	OCH2C(=O)NH2
Ме	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me '	OCH ₂ C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	OCH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	ОРЬ
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-C1)Ph
1	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-Br)Ph
1	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	O(2-F)Ph
	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	O(2-OMe)Ph
ŀ	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	O(2-NO ₂)Ph
1	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-CN)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-C1)Ph
1	Me	H	н	2	H	H	CF ₈	Me	O(3-Br)Ph
1	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	О(3-F)РЬ
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₈	Me	O(3-Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-OMe)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-NO2)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-CN)Ph

Me Me	H	н	2	н	н	CF ₈	Me	O(3-C(=O)OMe)Ph
Me Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Me	O(4-C1)Ph
Ме Ме	H	н	2	H	H	CF ₃	Ме	O(4-Br)Ph
Me Me	H	H	2	н	H	CF3	Me	О(4-F)РЬ
Ме Ме	н	н	2	н	н	CF ₃	Me	O(4-Me)Ph
Me Me	H	н	2	н	H	CF ₃	Me	O(4-OMe)Ph
Me Me	н	н	2	H	H	CF ₃	Me	O(4-NO ₂)Ph
Me Me	н	H	2	н	H	CF ₃	Me	O(4-CN)Ph
Me Me	н	H	2	н	н	CF ₃	Me	O(4-C(=O)OMe)Ph
Me Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)Me
Ме Ме	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)Et
Me Me	H	н	2	н	H	CF ₃	Me	OC(=O)CH ₂ Ph
Me Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)CF ₈
Ме Ме	н	н	2	H	H	CF ₈	Ме	OC(=O)Ph
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OSO ₂ Me
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OSO₂Et
Me Me	H	н	2	H	H	CF3	Me	OSO ₂ CH ₂ Ph
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OSO ₂ CF ₈
Me Me	H	H	2	Ħ	H	CF ₃	Me	OSO₂Ph
Ме Ме	H	H	2	H	H	CF3	Me	SMe
Me Me	H	H	2	H	H	CF3	Ме	SOMe
Ме Ме	H	H	2	H	H	CF3	Ме	SO ₂ Me
Ме Ме	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SEt
Me Me	н	H	2	H	H	CF ₈	Me	SOEt
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Ме	SO ₂ Et
Ме Ме	H	Н	2	H	H	CF ₈	Me	SPr
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	SOPr
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	SO ₂ Pr
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	SPri
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOPri
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	SO ₂ Pr-i
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ме	SBu-t
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Ме	SOBu-t
Me Me	H	H	2	н	H	CF ₃	Ме	SO ₂ Bu-t
Me Me	H	н	2	H	н	CF ₃	Ме	SCHF ₂
Me Me	H	н	2	н	H	CF ₈	Ме	SOCHF ₂
Ме Ме	H	H	2	н	H	CF8	Ме	SO ₂ CHF ₂
Me Me	H	H	2	H	н	CF ₃	Me	SCF3

l	L.	1	I	ı	1	l	1	1.	1
ł	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOCF ₃
1	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CF ₃
1	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SPh
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me ·	SOh
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ме	SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ме	SCH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOCH₂Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF3	Ме	SO ₂ CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	SCH ₂ C(=O)OEt
Me	Ме	н	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOCH2C(=O)OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)OEt
Me	Me	н	н	2	H	H	CF ₃	Me	SCH(Me)C(=O)OEt
Me	Me	н	H	2	н	H	CF ₃	Me	SOCH(Me)C(=O)OEt
Me	Me	H	H	2	н	H	CF3	Me	SO ₂ CH(Me)C(=O)OEt
Me	Me	H	H	2	н	H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)NH ₂
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Me	SOCH ₂ C(=O)NH ₂
Me	Me	H	H	2	H	н	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=0)NH ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	SCH₂C(=O)NHMe
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Me	SOCH ₂ C(=0)NHMe
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)NHMe
Ме	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOCH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=0)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	NH2
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	N(Me) ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF3	Me	N(Me)C(=0)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ме	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ме	NHSO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Мe	H	H	2	H	H	CF3	Ме	NHSO2CF3
Me	Me	H	H	2	н	H	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF3	Me	NHPh
Me	Me	н	н	2	н	H	CF ₃	Ме	N(Me)Ph
Me	Me	н	н	2	H	Ħ	CF3	Me	CN
Me	Ме	н	н	2	H	н	CN	Me	CF ₈

Me Me	H	H	2	н	H	CF ₈	Me	C(=O)OMe
Me Me	H	н	2	н	H	CF3	Me	C(=0)OP r -i
Me Me	H	H	2	H	H	CF3	Ме	C(=O)OCH ₂ Ph
Me Me	H	н	2	H	H	CF3	Me	C(=0)OPh
Ме Ме	H	н	2	н	H	CF3	Ме	C(=0)NH2
Me Me	н	н	2	н	H	CF ₃	Me	C(=O)NHMe
Me Me	н	н	2	н	H	CF ₈	Ме	C(=0)N(Me)2
Me Me	н	н	2	H	H	CF ₃	Me	C(=0)Me
Me Me	н	н	2	H	H	CF ₈	Me	C(=0)CF ₈
Ме Ме	н	H	2	H	H	CF ₈	Ме	C(=O)CH ₂ Ph
Me Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Me	C(=0)Ph
Me Me	H	H	2	н	H	CF ₈	Me	Me
Me Me	H	н	2	H	H	Me	Me	CF3
Me Me	н	H	2	н	H	CF3	Me	Et
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	Pr-i
Me Me	H	н	2	H	H	CF3	Me	Pr
Me Me	H	н	2	н	H	CF₃	Ме	CH₂OMe
Me Me	H	н	2	H	н	CF8	Me	CF ₃
Me Me	H	н	2	H	н	CF ₈	Me	CHF ₂
Me Me	H	H	2	H	H	CF3	Me	Ph
Me Me	н	H	2	H	H	CF2CF3	Me	Cl
Me Me	H	H	2	н	н	CN	Me	F
Me Me	H	H	2	H	H	F	Me	CN
Me Me	H	H	2	H	H	CN	Me	C1 ·
Me Me	H	н	2	н	H	C1	Ме	CN
Me Me	H	H	2	H	н	CN	Me	CN
Me Me	н	H	2	H	H	COOMe	Me	F
Me Me	H	H	2	H	H	F	Ме	COOMe
Me Me	н	H	2	H	H	COOMe	Me	CI
Me Me	H	H	2	н	H	C1	Me	COOMe
Me Me	H	H	2	н	н	SO ₂ Me	Me	C1
Me Me	н	H	2	H	н	C1	Me	SO₂Me
Me Me	н	н	2	H	н	Ph	Me	Me
Me Me	н	H	2	н	н	Ph	Me	Cı
Me Me	н	H	2	н	н	Ph	Me	OEt
Me Me	н	H	2	Н	н	Ph	Me	CF ₈
Me Me	н	H	2	н	н	Ph	Me	Ph
Me Me	н	H	2	н	н	Me	Et	OCHF2

Me	Me	H	H	2	н	н	OCHF2	Et	Ме
Me	Me	H	H	2	н	н	Me	Et	CN
Me	Me	н	H	2	н	H	CN	Et	Me
Me	Me	H	H	2	н	H	Pr-i	Et	OCHF2
Me	Me	H	H	2	н	H	OCHF2	Et	Pr-i
Me	Me	H	H	2	н	н	Pr-i	Et	CN
Me	Me	H	H	2	н	H	CN	Et	Pr-i
Me	Me	H	H	2	н	н	Cl	Et	Cı
Me	Me	H	H	2	н	H	OCHF2	Et	CI
Me	Me	H	H	2	н	H	Cı	Et	OCHF2
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF2	Et	OCHF2
Me	Me	H	H	2	H	H	CF3	Et	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Et	CF ₈
Me	Me	H	н	2	H	H	CF3	Et	CI
Me	Me	H	H	2	H	H	Cı	Et	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Et	OMe
Me	Me	H	H	2	н	H	ОМе	Et	CF₃
Me	Me	H	н	2	н	H	CF ₈	Et	OEt
Me	Me	H	н	2	H	H	OEt	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	н	H	CF ₃	Et	OCHF2
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF2	Et	CF ₈
Me	Me	H	H	2	н	H	CF ₃	Et	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	н	H	CF ₃	Et	Ме
Me	Me	H	H	2	н	H	Me	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Ме	Pr-i	OCHF2
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF2	Pr-i	Ме
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Pr-i	CN
Me	Me	H	н	2	H	H	CN	Pr-i	Ме
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Pr-i	OCHF2
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF2	Pr-i	Pri
Me	Me	H	H	2	н	H	Pr-i	Pr-i	CN .
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Pr-i	Pr-i
Me	Me	н	H	2	н	H	C1	Pr-i	CI
Me	Me	н	н	2	H	H	OCHF2	Pr-i	Cl
Me	Me	н	H	2	H	H	C1	Pr-i	OCHF2
Me	Me	н	H	2	н	H	OCHF2	Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	н	2	H	H	CF3	Pr-i	F
•			•	•	•		-	.	'

Me	Me	н	н	2	н	H	F	Pr-i	CF ₈
Me	Me	н	H	2	н	H	CF ₈	Pr-i	Cı
Me	Me	H	н	2	н	H	Cı	Pr-i	CF ₃
Me	Ме	H	H	2	н	H	CF ₃	Pr-i	ОМе
Ме	Me	н	H	2	н	H	OMe	Pr-i	CF ₃
Ме	Me	н	н	2	н	H	CF3	Pr-i	OEt
Me	Me	Ħ	н	2	н	H	OEt	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Pr-i	OCHF2
Ме	Me	н	н	2	H	H	OCHF2	Pr-i	CF3
Ме	Me	H	н	2	н	H	CF ₈	Pr-i	CN
Ме	Me	H	H	2	H	H	CN	P r- i	CF ₈
Me	Me	H	H	2	н	H	CF ₃	P r- i	Me
Me	Me	H	н	2	н	H	Me	Pr-i	CF3
Me	Me	H	H	2	н	H	Me	Pr ·	OCHF2
Ме	Me	H	H	2	н	H	OCHF2	Pr	Me
Ме	Me	H	н	2	н	H	Ме	Pr	CN
Ме	Me	Ħ	н	2	н	H	CN	Pr	Me
Me	Me	Ħ	H	2	н	H	P r i	Pr	OCHF2
Ме	Me	H	н	2	н	H	OCHF2	Pr	Pr-i
Me	Me	H	н	2	Ħ	H	Pr-i	Pr	CN
Me	Me	H	н	2	H	H	CN	Pr	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CI	Pr	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF2	Pr	Cl
	Me	H	H	2	H	H	C1	Pr	OCHF2
	Me	H	H	2	H	H	OCHF2	Pr	OCHF ₂
	Me	H	H	2	H	H	CF ₈		F
	Me	H	H	2	H	H	F	Pr	CF ₈
	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr	Cl
	Me	H	H	2	H	H	Ci	Pr	CF ₃
	Me	H	H	2	H	H	CF ₈		OMe
	Me	H	H	1	H	H	OMe		CF ₈
İ	Me	H	H	1 1	H		CF ₈		OEt CTE
	Me	H .	H	, ,	H	H	OEt	Pr	CF ₃
	Me	H	H	í 1	H	H	CF ₃	Pr	OCHF2
	Me	H	H	1 1	H	H	OCHF ₂	Pr ·	CF ₃
	Me	H	H	, ,	H	H	CF ₈	Pr	CN
	Me	H	H	1 1	H	H	CN	Pr _	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr	Me

								•		
1	Иe	Me	н	H	2	н	н	Me	Pr	CF ₃
1	Ме	Me	н	H	2	н	H	Me	Bu-t	F
I	И́е	Me	H	H	2	н	H	Me	Bu-t	CI
I	И́е	Me	H	H	2	H	н	Me	Bu-t	OCHF ₂
7	Мe	Me	H	H	2	н	н	Me	Bu-t	CN
N	И́е	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-t	CI
V	Лe	Me	н	H	2	н	H	OCHF2	Bu-t	C1
V	Лe	Me	Н	H	2	н	H	OCHF2	Bu-t	OCHF2
J	Лe	Me	н	H	2	н	н	CF3	Bu-t	н
V	Лe	Me	Н	H	2	н	H	CF3	Bu-t	F
V	Лe	Me	н	H	2	н	н	CF ₃	Bu-t	CI
V	ſе	Me	H	H	2	H	н	Cı	Bu-t	CF ₃
M	ſе	Me	н	H	2	H	н	CF3	Bu-t	OMe
M	1e	Me	н	H	2	н	Н	ОМе	Bu-t	CF ₃
M	ſе	Me	н	H	2	н	H	CF ₈	Bu-t	OEt
M	ſе	Me	н	H	2	н	H	OEt	Bu-t	CF ₃
M	le	Me	н	H	2	H	Н	CF ₃	Bu-t	OCHF2
M	ſе	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-t	CN
1	- 1	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-t	Me
1	- 1	Me	H	H	2	H	H	Ме	Bu-t	CF ₃
	- 1	Me	H	H	2	H	н	CF ₃	Bu-s	CI
1	- 1	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-s	CF ₃
Ł	- 1	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-i	C1
1	J	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-i	CF ₃
ł	- 1	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu	C1
	- 1	Me	H	H	2	H	H	C1	Bu	CF ₂
1	- 1	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	1-Methylbutyl	[CI
ŀ	- 1	Me	H	H	2	H	H	CI	1-Methylbutyl	CF ₃
1	- 1	Me	H	H	2	H		CF ₃	1-Ethylpropyl	CI
1	- 1	Me	H	H		H		CI	1-Ethylpropyl	CF ₈
1	- 1	Me	H	H	2	H		CF ₃	1-Pentyl	C1
ı	- 1	Me	H	H	2	H	_ i	Cl	1-Pentyl	CF ₈
,	- 1	Me	H	H	2	H	- 1	CF ₃	1-Methylpentyl	C1
1		Me	H	H	2	H		Cl	1-Methylpentyl	CF ₈
	- 1	Me	H	Ħ	2	H	1	CF ₃	2-Ethylbutyl	CI
1	- 1	Me	H	H	2	H	Н	Cl	2-Ethylbutyl	CF ₃
1	- 1	Me	H	H	2	H		CF ₈	3,3-Dimethylbutyl	CI
M	e	Ме	H	H	2	H	H	Ci	3,3-Dimethylbutyl	CF₃

		. 1			ı		1	1
Ме Ме	H	H	2	H	H	CF ₈	1-Hexyl	Cl
Ме Ме	H	H	2	H	H	CI	1-Hexyl	CF ₃
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₃	1-Heptyl	CI
Me Me	н	H	2	H	H	CI	1·Heptyl	CF ₃
Ме Ме	н	H	2	H	H	CF ₃	1-Octyl	Cl
Me Me	н	H	2	H	H	C1	1-Octyl	CF ₈
Ме Ме	н	н	2	H	н	CF ₃	CH ₂ Ph	Cl
Me Me	н	н	2	н	H	Cl	CH₂Ph	CF ₃
Ме Ме	н	н	2	H	H	CF ₈	Pr-c	F
Ме Ме	н	H	2	н	H	CF ₈	Pr-c	Cı
Me Me	н	н	2	н	H	CF ₃	Pr-c	ОМе
Me Me	н	H	2	н	н	CF ₃	Pr-c	OCHF2
Me Me	H	н	2	н	H	CF3	Pr-c	CN
Me Me	н	H	2	н	H	CF3	Pen-c	CI
Me Me	н	н	2	н	н	Cı	Pen-c	CF ₃
Ме Ме	н	H	2	н	H	CF ₃	Hex-c	CI
Me Me	н	н	2	н	н	Cı	Hex-c	CF ₃
Me Me	н	н	2	H	н	Me	CH ₂ Pr-c	OCHF2
Me Me	н	н	2	н	H	OCHF2	CH ₂ Pr-c	Me
Me Me	н	H	2	н	н	Cl	CH ₂ Pr-c	CI
Me Me	н	н	2	н	H	OCHF ₂	CH ₂ Pr-c	Cl
Ме Ме	н	H	2	н	н	Cl	CH ₂ Pr-c	OCHF2
Me Me	н	н	2	н	H	OCHF2	CH ₂ Pr·c	OCHF2
Me Me	н	н	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	F
Me Me	H	Н	2	H	н	F	CH2Pr-c	CF ₃
Me Me	н	н	2	н	H	CF ₃	CH2Pr-c	CI
Me Me	н	н	2	н	H	C1	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me Me	н	H	2	н	н	CF ₃	CH2Pr-c	OH
Me Me	H	н	2	H	н	CF ₈	CH₂Pr-c	ОМе
Me Me	н	H	2	н	H	OMe	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me Me	н	H	2	н	н	CF ₃	CH2Pr-c	OEt
Me Me	H	H	2	н	н	OEt	CH2Pr-c	CF ₈
Me Me	н	H	2	H	н	CF ₃	CH2Prc	OPr-i
Me Me	H	н	2	н	н	CF ₃	CH₂Pr·c	OPr
Me Me	н	H	2	н	н	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OBu-t
Me Me	н	H	1	н	н	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c
Me Me	H	н	ŀ	н	H	CF ₃	CH₂Pr-c	OCH ₂ Bu·c
Ме Ме	H	H		н	н	CF ₈	CH₂Pr-c	OPen-c
11	ı —	1	1 -	_	1	1	ı	1 1

	_			_	_				
Me	Ме	н	H	2	н	н	CF ₃	CH ₂ P _{r-c}	OCHF ₂
Me	Ме	н	H	2	н	н	OCHF2	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Ме	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	CN
Me	Me	H	H	2	н	н	CN	CH ₂ Pr-c	CF3
Me	Me	н	H	2	н	н	CF3	CH ₂ Pr-c	Ме
Me	Me	н	H	2	н	H	Me	CH2Pr-c	CF ₈
Me	Me	н	Н	2	H	н	CF ₃	1-cyclopropylethyl	cı
Me	Me	н	H	2	н	н	C1	1-cyclopropylethyl	CF ₃
Me	Me	н	н	2	н	н	CF ₈	CH2(2-Methylcyclopropyl)	cı .
Me	Me	H	н	2	н	н	Cı	CH2(2-Methylcyclopropyl)	CF ₃
Me	Me	н	н	2	н	н	CF ₃	CH ₂ (2,2·Dimethylcyclopropyl)	CI
Me	Ме	н	н	2	н	н	Cı	CH ₂ (2,2-Dimethylcyclopropyl)	CF ₃
Me	Ме	н	H	2	H	H	CF ₃	CH2(2-Chlorocyclopropyl)	CI
Me	Me	H	H	2	H	Ħ	C1	CH2(2-Chlorocyclopropyl)	CF₃
Ме	Ме	н	H	2	н	н	CF3	CH2(2,2-Dichlorocycloprop yl)	CI
	Me	H	н	2	H	Ĥ	Cl	CH2(2,2-Dichlorocycloprop yl)	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH2(2-Fluorocyclopropyl)	CI
Me	Me	H	H	2	H	H	CI	CH2(2-Fluorocyclopropyl)	CF ₈
Ме	Ме	H	н	2	H	H	CF ₃	CH2(2,2-Difluorocyclopropyl)	C1
Me	Ме	н	н	2	н	н	CI	CH2(2,2-Difluorocyclopropyl)	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Bu·c	CI.
Me	Me	H	н	2	H	H	Cl	CH₂Bu·c	CF ₃
Me	Me	H	н	2	H	H	CF₃	CH₂Pen-c	cı
Me	Me	H	H	2	Ħ	H	Cl	CH2Pen·c	CF ₃
Ме	Ме	H	H	2	H	H	CF ₃	СН2Нех-с	C1
Me	Me	н	н	2	H	H	Cl	CH2Hex-c	CF3
Me	Me	H	Н	2	H	H	CF ₈	CH2CH2Pr-c	Cl
Me	Me	H	н	2	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ P _T -c	CF ₃
Me	Me	н	H	2	H	H	CF ₃	CH2CH=CH2	CI
Me	Me	H	H	2	H	H	CI	CH₂CH=CH₂	CF ₃
Me	Ме	H	H	2	H	H	CF ₈	CH₂CH=CHCl	Cl
Me	Ме	H	H	2	н	н	CI	CH₂CH=CHCl	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CH₂C≡CH	OCHF ₂
Me	Me	H	н	2	H	н	OCHF ₂	CH₂C≡CH	Me
Me	Me	Ħ	H	2	H	н	Cl	CH₂CCH	Cl
Ме	Me	Ħ	H	2	H	H	OCHF2	CH₂C≡CH	Cl

Me Me										
Me Me H H 2 H H CFs CHsC≡CH F Me Me H H 2 H H F CHsC≡CH CFs Me Me H H 2 H H CFs CHsC≡CH CFs Me Me H H 2 H H CPs CHsC≡CH CFs Me Me H H 2 H H CPs CHsC≡CH CFs Me Me H H 2 H H CPs CHsC≡CH CFs Me Me H H 2 H H CPs CHsC≡CH CFs Me Me H H 2 H H CPs CHsC≡CH CFs Me Me H H 2 H H CPs CHsC≡CH CPs Me Me <	Me Me		H	H	2	H	H	Cl	CH₂C≡CH	OCHF2
Me Me H H Z H H F CHaC≡CH CF3 Me Me H H Z H H CF3 CHaC≡CH CCF3 Me Me H H Z H H CF3 CHaC≡CH CMe Me Me H H 2 H H CMaC≡CH CMe Me Me H H 2 H H CMaC≡CH CMaC Me Me H H 2 H H CMaC≡CH CDE Me Me H H 2 H H CF3 CHaC≡CH CCF3 Me Me H H 2 H H CF3 CHaC≡CH CCF3 Me Me H H 2 H H CF3 CHAC≡CH CCF3 Me Me H H 2	Me Me		н	H	2	н	H	OCHF2	CH₂C≡CH	OCHF ₂
Mo Me H H L H CFs CHsC≡CH CI Me Me H H 2 H H CI CHsC≡CH CFs Me Me H H 2 H H CFs CHsC≡CH OMe Me Me H H 2 H H CFs CHsC≡CH OEt Me Me H H 2 H H CFs CHsC≡CH OETs Me Me H H 2 H H CFs CHsC≡CH OCFs Me Me H H 2 H H CFs CHsC≡CH CFs Me Me H H 2 H H CFs CHsC≡CH CFs Me Me H H 2 H H CFs CHsC≡CH CFs Me Me H	Me Me		н	H	2	H	H	CF ₈	CH ₂ C≡CH	F
Me Me H H 2 H H CI CH2C≡CH CF3 Me Me H H 2 H H CF3 CH2C≡CH OMe Me Me H H 2 H H OMe CH2C≡CH OEt Me Me H H 2 H H CF3 CH3C≡CH OEt Me Me H H 2 H H CF3 CH3C≡CH OCHF2 Me Me H H 2 H H OCHF2 CH3C≡CH OCHF2 Me Me H H 2 H H OCHGE□CH CF3 Me Me H H 2 H H CF3 CH3C□C□CH CF3 Me Me H H 2 H H CF3 CH3C□C□CH CF3 Me Me H H 2 H H CF3 CH4C□C□CH CF3	Me Me	ł	н	H	2	H	H	F	CH₂C≡CH	CF ₃
Me Me H H 2 H H CP3 CH3C≡CH OMe Me Me H H 2 H H OMe CH3C≡CH CF3 Me Me H H 2 H H CF3 CH3C≡CH CF3 Me Me H H 2 H H CF3 CH3C≡CH CCF3 Me Me H H 2 H H CF3 CH3C≡CH CCF3 Me Me H H 2 H H CCF3 CH3C≡CH CCF3 Me Me H H 2 H H CP3 CH3C≡CH CCF3 Me Me H H 2 H H CF3 CHMC≡CH CCF3 Me Me H H 2 H H CR3 CHAC≡CH CCF3 Me Me <td>Me Me</td> <td> </td> <td>H</td> <td>H</td> <td>2</td> <td>н</td> <td>H</td> <td>CF₃</td> <td>CH₂C≡CH</td> <td>CI</td>	Me Me		H	H	2	н	H	CF ₃	CH₂C≡CH	CI
Me Me H H L 2 H H OMe CH2C≡CH CF3 Me Me H H 2 H H CF3 CH2C≡CH OEt Me Me H H 2 H H CF3 CH2C≡CH OCHF2 Me Me H H 2 H H CH3C≡CH CCF3 Me Me H H 2 H H CH3C≡CH CCN Me Me H H 2 H H CH3C≡CH CCN Me Me H H 2 H H CF3 CH3C≡CH CCN Me Me H H 2 H H CF3 CH4C≡CH CF3 Me Me H H 2 H H CCP3 CH4C≡CH CCP3 Me Me H H	Me Me	.	н	H	2	H	н	C1	CH₂C≡CH	CF ₃
Me Me H H 2 H H CF3 CHsC≡CH OEt Me Me H H 2 H H OCHF2 CHsC≡CH OCHF2 Me Me H H 2 H H CF3 CHsC≡CH CCF3 Me Me H H 2 H H CF3 CHsC≡CH CCN Me Me H H 2 H H CN CHsC≡CH CCN Me Me H H 2 H H CN CHsC≡CH CCN Me Me H H H CF3 CHsC≡CH CF3 Me Me H H H CF3 CHsC≡CH CCF3 Me Me H H H CF3 CHsC≡CH CCF3 Me Me H H H CF3 CHsC≡CH <th< td=""><td>Me Me</td><td>. }</td><td>H</td><td>H</td><td>2</td><td>H</td><td>H</td><td>CF₃</td><td>CH₂C≡CH</td><td>OMe</td></th<>	Me Me	. }	H	H	2	H	H	CF ₃	CH₂C≡CH	OMe
Me Me H H 2 H H OEt CHsC=CH CFs Me Me H H 2 H H CFs CHsC=CH CCFs Me Me H H 2 H H CFs CHsC=CH CCFs Me Me H H 2 H H CFs CHsC=CH CCN Me Me H H 2 H H CFs CHsC=CH CCN Me Me H H 2 H H CMsC=CH CCTs Me Me H H 2 H H CFs CHGC=CH CCTs Me Me H H 2 H H CFs CHMcC=CH CCTs Me Me H H 2 H H CFs CHMcC=CH CCTs Me Me H	Me Me	.	H	H	2	н	H	OMe	CH₂C≡CH	CF ₃
Me Me H H 2 H H CFs CHsC≡CH OCHF2 Me Me H H 2 H H OCHF2 CHsC≡CH CFs Me Me H H 2 H H CFs CHsC≡CH CN Me Me H 2 H H CFs CHsC≡CH CFs Me Me H 2 H H CFs CHsC≡CH CFs Me Me H 2 H H CFs CHsC≡CH CI Me Me H 2 H H CFs CHMC=CH CH CFs Me Me H H 2 H H CH CH CFs CHsC≡CH CFs Me Me H H 2 H H CH CHsC≡CH CFs CH CFs CH CFs <td>Me Me</td> <td>. </td> <td>H</td> <td>H</td> <td>2</td> <td>H</td> <td>H</td> <td>CF₃</td> <td>CH₂C≡CH</td> <td>OEt</td>	Me Me	.	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CH	OEt
Me Me H H 2 H H OCHF2 CH3C≡CH CFs Me Me H H 2 H H CFs CH3C≡CH CN Me Me H H 2 H H CN CH3C≡CH CFs Me Me H H 2 H H Me CH3C≡CH CFs Me Me H H 2 H H CFs CH4C≡CH CI Me Me H H 2 H H CI CHMeC≡CH CI Me Me H H 2 H H CI CHMeC≡CH CFs Me Me H H 2 H Me CHF2 F Me Me H H 2 H Me CHF2 Me Me Me H H H	Me Me		H	H	2	H	H	OEt	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me Me H H 2 H H CF3 CH2C≡CH CR Me Me H H 2 H H CN CH2C≡CH CF3 Me Me H H CF3 CHMCC≡CH CP3 Me Me H H CF3 CHMCC≡CH CI Me Me H H CP3 CHMCC≡CH CT3 Me Me H H CH CT3 CHMCC≡CH CT3 Me Me H H CH CT3 CHMCC≡CH CT3 Me Me H H CH CHF2 CME CCH3 Me Me H H CH CHF2 CME CCT3 Me Me H H H Me CHF2 Me Me Me H H Me CHF2 Me Me <	Me Me		н	H	2	H	н	CF ₃	CH ₂ C≡CH	OCHF2
Me Me H H 2 H H CN CH2C≡CH CF3 Me Me H H 2 H H CF3 CH2C≡CH Me Me Me H H 2 H H Me CH3C≡CH CI Me Me H H 2 H H CG3 CHMeC≡CH CG3 Me Me H H 2 H H CG3 CHMeC≡CH CG3 Me Me H H 2 H H CG3 CHMeC≡CH CG3 Me Me H H 2 H H CG43C≡CMe CG1 Me Me H H 2 H H CG3C≡CMe CG1 Me Me H H 2 H H CG1 CH52 Me Me H H 2 H H CH CHF2 Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me H	Me Me	,	н	н	2	H	H	OCHF2	CH₂C≡CH	CF ₈
Me Me H H 2 H H CFs CHsC≡CH Me Me Me H H 2 H H Me CHsC≡CH CCFs Me Me H H 2 H H CCFs CCHMeC≡CH CCFs Me Me H H 2 H H CCFs CCHMeC≡CH CCFs Me Me H H 2 H H CCFs CCHMeC≡CMe CCI Me Me H H 2 H H CCFs CCMe CCFs Me Me H H 2 H H Me CCHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CCHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CCHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CCHF2 Me Me	Me Me	,	H	н	2	H	H	CF ₈	CH₂C≡CH	CN
Me Me H H 2 H H CFs CHMeC≡CH CI Me Me H H 2 H H CFs CHMeC≡CH CI Me Me H H 2 H H CI CHsC≡CMe CI Me Me H H 2 H H CI CHsC≡CMe CI Me Me H H 2 H H CI CHsc≡CMe CFs Me Me H H 2 H H Me CHF2 F Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H H H H Me CHF2 Me Me Me H H H H H H H H H H Me CHF2	Me Me	.]	H	н	2	H	H	CN	CH ₂ C≡CH	CF ₈
Me Me H H 2 H H CHMeC≡CH CI Me Me H H 2 H H CI CHMeC≡CMe CI Me Me H H 2 H H CI CH2C≡CMe CI Me Me H H 2 H H CI CH2c≡CMe CI Me Me H H 2 H H CI CH2c≡CMe CF3 Me Me H H 2 H H Me CHF2 F Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H H H H Me CHF2 Me Me Me H <t< td=""><td>Me Me</td><td>,</td><td>H</td><td>H</td><td>2</td><td>H</td><td>H</td><td>CF₃</td><td>CH₂C≡CH</td><td>Ме</td></t<>	Me Me	,	H	H	2	H	H	CF ₃	CH₂C≡CH	Ме
Me Me H H 2 H H CI CHMeC≡CH CI Me Me H H 2 H H CI CH2C≡CMe CI Me Me H H 2 H H CI CHF2 F Me Me H H 2 H H F CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 CI Me Me H H 2 H H Me CHF2 CI Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H	Me Me	,	H	H	2	H	H	Me	CH ₂ C≡CH	CF ₈
Me Me H H 2 H H CF3 CH2C≡CMe CI Me Me H H 2 H H CI CHF2 ≡ CMe CF3 Me Me H H 2 H H Me CHF2 F Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Et Me Me H	Me Me	,	H	н	2	H	H	CF ₈	CHMeC≡CH	CI
Me Me H H 2 H H CH CH2C≡CMe CF3 Me Me H H 2 H H Me CHF2 F Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 OMe Me Me H H 2 H H OMe CHF2 OMe Me Me H H 2 H H OMe CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H CI CHF2 Et Me Me H	Me Me	,	H	н	2	H	H	CI	CHMeC≡CH	CF ₃
Me Me H H 2 H H Me CHF2 F Me Me H H 2 H H F CHF2 Me Me Me H H 2 H H CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 OMe Me Me H H 2 H H Me CHF2 OCHF2 Me Me H H 2 H H Me CHF2 CN Me Me H H 2 H H CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Et CHF2 Et Me Me H H H H H	Me Me	,	Ħ	н	2	H	H	CF ₃	CH₂C≡CMe	[CI
Me Me H H 2 H H F CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 CI Me Me H H 2 H H Me CHF2 OMe Me Me H H 2 H H Me CHF2 OCHF2 Me Me H H 2 H H Me CHF2 OCHF2 Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H CHF2 Me Me Me H H 2 H H Et CHF2 CI Me Me H H 2 H H Et CHF2 Et Me Me H H 2	Me Me	•	H	H	2	H	H	CI	CH ₂ C≡CMe	CF ₃
Me Me H H 2 H H Me CHF2 CI Me Me H H 2 H H CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 OCHF2 Me Me H H 2 H H Me CHF2 OCHF2 Me Me H H 2 H H Me CHF2 CN Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H CHF2 CI Me Me H H 2 H H CHF2 Et Me Me H H 2 H H CH CHF2 CI Me Me H H 2 H <td< td=""><td>Me Me</td><td>•</td><td>H</td><td>н</td><td>2</td><td>H</td><td>H</td><td>Ме</td><td>CHF2</td><td>F</td></td<>	Me Me	•	H	н	2	H	H	Ме	CHF2	F
Me Me H H 2 H H CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 OMe Me Me H H 2 H H OMe CHF2 Me Me Me H H 2 H H OCHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 CN Me Me H H 2 H H CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H CH CHF2 CI Me Me H H 2 H H CH CHF2 CI Me Me H H 2 H H CH CHF2 CI Me Me H H 2 H H<	Me Me	3	H	н	2	H	H	F	CHF ₂	Ме
Me Me H H 2 H H Me CHF2 OMe Me Me H H 2 H H OMe CHF2 Me Me Me H H 2 H H OCHF2 CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me Me Me Me H H 2 H H Et CHF2 Et Me Me H H H H H Et CHF2 Et Me Me H H H H H H H Fri Me Me H <td>Me Me</td> <td>9</td> <td>н</td> <td>H</td> <td>2</td> <td>H</td> <td>н</td> <td>Me</td> <td>CHF₂</td> <td>CI</td>	Me Me	9	н	H	2	H	н	Me	CHF ₂	CI
Me Me H H 2 H H 0Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 OCHF2 Me Me H H 2 H H OCHF2 CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 CN Me Me H H 2 H H CN CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Et CHF2 Cl Me Me Me H H 2 H H Et CHF2 Et Me Me Me H H 2 H H Et CHF2 Et Me Me Me H H 2 H H Et CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Et CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Et CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Et CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl	Me Me	9	H	н	2	H	н	Cl	CHF ₂	Ме
Me Me H H 2 H H Me CHF2 OCHF2 Me Me H H 2 H H OCHF2 CHF2 Me Me Me H H 2 H H CN CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H CHF2 CI Me Me H H 2 H H CHF2 Et Me Me H H 2 H H Pr-i CHF2 CI Me Me H H 2 H H CI CHF2 Pr-i Me Me H H 2 H H CI CHF2 CI	Me Me	е	н	н	2	н	н	Me	CHF ₂	ОМе .
Me Me H H 2 H H OCHF2 CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Et CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Et CHF2 Et Me Me H H 2 H H Pr-i CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl	Me Me	е	н	н	2	H	н	ОМе	CHF ₂	Ме
Me Me H H 2 H H Me CHF2 CN Me Me H H 2 H H CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Et Me Me H H 2 H H Et CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Pr-i CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl	Me Me	е	H	H	2	H	H	Me	CHF ₂	OCHF2
Me Me H H 2 H H CN CHF2 Me Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Et Me Me H H 2 H H Et CHF2 Et Me Me H H 2 H H Pr-i CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl	Me Me	В .	н	H	2	H	H	OCHF2	CHF2	Me
Me Me H H 2 H H Me CHF2 Me Me Me H H 2 H H Et CHF2 Et Me Me H H 2 H H Et CHF2 Et Me Me H H 2 H H Pr-i CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl	Me Me	В	н	H	2	H	н	Me	CHF2	CN
Me Me H H 2 H H Et CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Et Me Me H H 2 H H Et CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Pr-i Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl	Me M	е	н	H	2	H	H	CN	CHF ₂	Me .
Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Et Me Me H H 2 H H Et CHF2 Et Me Me H H 2 H H Pr-i CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl	Me M	е	н	н	2	H	H	Me	CHF ₂	Me
Me Me H H 2 H H Et CHF2 Et Me Me H H 2 H H Pr-i CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Pr-i Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl	Me M	е	H	H	2	H	н	Et	CHF ₂	CI
Me Me H H 2 H H Pr-i CHF2 Cl Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Pr-i Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl	Me M	е	н	H	2	H	H	Cı	CHF ₂	Et
Me Me H H 2 H H C1 CHF2 Pr-i Me Me H H 2 H H C1 CHF2 Cl	Me M	е	н	н	2	H	H	Et	CHF ₂	Et
Me Me H H 2 H H Cl CHF2 Cl	Me M	е	н	H	2	H	н	Pr-i	CHF ₂	Cı
	Me M	е	н	H	2	H	H	CI	CHF ₂	Pr-i
	Me M	e	H	H	2	н	н	CI	CHF ₂	CI
	Me M	e	H	H	2	H	н	OCHF2	CHF2	CI

Me	Me	H	Н	2	H	H	Cı	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	н	H	OCHF2	CHF ₂	OCHF2
Me	Me	н	H	2	H	H	CF ₈	CHF ₂	CI
Me	Me	H	H	2	H	H	CI	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	F
Me	Me	н	H	2	н	н	F	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	ОМе
Me	Ме	н	н	2	н	H	ОМе	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	н	H	CF ₃	CHF ₂	OEt
Me	Me	н	H	2	н	н	OEt	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	н	H	2	H	н	CF ₃	CHF ₂	OCHF2
Me	Me	н	H	2	H	H	OCHF2	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	н	H	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	CN
Me	Me	н	н	2	н	H	CN	CHF ₂	CF ₈
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	Me
Me	Me	н	н	2	н	H	Me	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	н	2	н	н	CF ₈	CH2CHF2	Cı
Me	Me	H	H	2	H	н	[CI	CH2CHF2	CF ₃
Me		H	H	2	H	H	CF ₃	CH2CF8	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CI	CH₂CF ₈	CF ₃
Me		H	H	2	H	H	CF ₈	CH ₂ OH	CI
Me	Me	Н	H	2	H	H	CI	СН₂ОН	CF ₃
Me		H	н	2	H	H	Ме	CH ₂ OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	Me
Me		н	H	2	H		Cl	CH₂OMe	[CI
Me		H	Н	2	H		OCHF ₂	CH ₂ OMe	CI
Me		H 	H	2	H		CI	CH ₂ OMe	OCHF ₂
Me		H	H	2	H		OCHF ₂	CH ₂ OMe	OCHF ₂
Me	1	H	H	2	H		CF ₃	CH ₂ OMe	F
Me		H	H		H		F 	CH₂OMe	CF ₃
Me		H	H		H	- 1	CF ₃	CH ₂ OMe	C1
Ме	, ,	H	H	2	H		Cl	CH ₂ OMe	CF ₈
Ме		H	H	2	H		CF ₈	CH₂OMe	OMe
Me	1	H	H	2	H		ОМе	CH₂OMe	CF ₈
Ме		H	H	2	H	- 1	CF ₈	CH₂OMe	OEt
Me		H	H	2	H		OEt	СН₂ОМе	CF ₃
Me	- 1	H	H	2	H	- 1	CF ₃	СН₂ОМе	OCHF2
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	CF ₃

Me	Me	H	н	2	н	н	CF ₃	CH₂OMe	CN
Me	Me	H	H	2	н	H	CN	CH ₂ OMe	CF3
Me	Me	H	н	2	H	Ħ	CF3	CH₂OMe	Me
Ме	Me	H	н	2	H	H	Me	CH₂OMe	CF3
Me	Me	н	н	2	н	H	CF3	CH ₂ OEt	Cl
Me	Me	H	н	2	н	H	Cl	CH ₂ OEt	CF ₈
Me	Me	н	H	2	н	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OH	Cı
Me	Me	н	н	2	н	H	Cl	CH₂CH₂OH	CF3
Me	Me	H	н	2	н	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OMe	Cı
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OMe	CF3
Me	Me	H	H	2	н	H	CF3	CH ₂ CH ₂ OEt	Cı
Me	Me	н	н	2	н	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OEt	CF ₃
Me	Me	н	н	2	н	H	CF ₃	CH₂NHMe	Cı
Me	Me	H	н	2	н	H	Cı	CH₂NHMe	CF ₃
Me	Me	н	н	2	н	H	CF ₈	CH2N(Me)2	Cl
Me	Me	н	н	2	н	H	Cı	CH ₂ N(Me) ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	CH2N(Me)C(=O)Me	C1
Ме	Me	н	н	2	н	н	CI	CH2N(Me)C(=O)Me	CF3
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	CH2N(Me)C(=O)CF3	Cl
Ме	Me	H	н	2	H	H	CI	CH2N(Me)C(=O)CF3	CF ₃
Ме	Мe	H	н	2	H	H	CF ₃	CH2N(Me)SO2Me	Cı
Me	Me	н	H	2	н	H	C1	CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	CF ₃
Me	Ме	H	H	2	H	H	CF ₃	CH2N(Me)SO2CHF2	Cl
Ме	Me	H	H	2	Ħ	H	Cı	CH2N(Me)SO2CHF2	CF ₃
Ме	Me	н	H	2	H	н	CF ₃	CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃	CI
Me	Me	H	н	2	H	н	C1	CH2N(Me)SO2CF3	CF ₃
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	CH₂SMe	Cl
Me	Me	H	н	2	H	н	CI	CH ₂ SMe	CF ₃
Me	Me	H	н	2	H	н	CF ₃	CH2SO2Me	Cl
Me	Me	н	н	2	H	н	CI	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₈
Me	Me	н	н	2	H	н	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CI
Me	Me	н	н	2	H	н	C1	CH ₂ CH ₂ SMe	CF ₃
Me	Me	н	н	2	H	H	CF ₈	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Cl
Me	Me	н	н	2	н	н	CI	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CF ₈
Me	Me	н	H	2	H	н	CF ₃	CH₂CN	Cı
Me	Me	н	н	2	н	н	Cı	CH₂CN	CF ₈
Me	Me	н	H	2	H	н	CF ₈	CH ₂ C(=O)OMe	Cı
Me	Me	н	н	2	н	н	Cı	CH ₂ C(=O)OMe	CF ₃

Me	Me	н	н	2	н	н	CF ₈	CH ₂ C(=O)OEt	Cl
Me	Me	H	H	2	н	н	Cı	CH ₂ C(=O)OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	н	н	CF3	CH(Me)C(=O)OMe	C1
Me	Me	H	H	2	H	H	Cı	CH(Me)C(=O)OMe	CF ₃
Me	Ме	H	H	2	H	н	CF3	C(Me) ₂ C(=O)OMe	Cı
Me	Me	H	H	2	H	H	cı	C(Me) ₂ C(=O)OMe	CF ₃
Me	Me	H	н	2	н	H	CF3	CH2C(=O)NH2	CI.
Ме	Me	H	н	2	H	н	CI	CH ₂ C(=O)NH ₂	CF ₃
Ме	Me	н	н	2	H	н	CF₃	CH2C(=O)NHMe	CI
Me	Me	H	H	2	н	н	Cı	CH2C(=O)NHMe	CF ₃
Me	Me	H	н	2	н	н	CF ₈	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	cı
Me	Me	H	н	2	H	H	C1	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	CF ₃
Me	Me	H	н	2	н	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)Me	CI
Ме	Ме	H	н	2	н	H	C1	CH ₂ C(=O)Me	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	н	CF8	CH ₂ C(=NOMe)Me	CI
Me	Me	H	н	2	H	H	C1	CH ₂ C(=NOMe)Me	CF ₃
Ме	Me	H	н	2	H	H	CF ₈	CH ₂ C(=O)CF ₃	C1
Me	Me	H	H	2	H	H	C1	CH ₂ C(=O)CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	CH ₂ CH ₂ C(=O)Me	C1
Ме	Me	H	H	2	H	H	Cı	CH ₂ CH ₂ C(=O)Me	CF ₃
1	Me	H	H	2	H	H	Ме	Ph	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Ph	F
1	Me	H	H	2	H	H	Ме	Ph	CI
Me	Me	H	비	2	H	H	Ме	Ph	OCHF ₂
1	Me	H	H	2	H	H	Ме	Ph	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Ph	F
1	Me	H	H	2	H	!	Et	Ph	[C1
1	Me	H	H	2	H	1	Et	Ph	OCHF2
1 .	Me	H	H	2	H	١.,	Et	Ph	CN
1	Me	H	H		H		Pr	Ph	F
i	Me	Ħ	H	1	H		Pr	Ph	Cl
1	Me	H	H	2	H	H	Pr	Ph	OCHF ₂
	Me.	H	H	2	H	H	Pr	Ph	CN
J .	Me	H	H	2	H	H	P r i	Ph	F
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Ph	CI
Me	Ме	H	H	2	H	H	Pr-i	Ph	OCHF ₂
Me	Ме	H	H	2	H	H	Pr-i	Ph	CN
Ме	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Ph	Cl

	•								
Me	Me	н	H	2	н	н	CH ₂ OMe	Ph	CI
Me	Me	H	H	2	н	н	Cl	Ph	C1
Me	Me	H	H	2	H	н	OCHF2	Ph	CI
Me	Me	H	н	2	н	H	OCHF2	Ph	OCHF2
Me	Me	н	н	2	н	H	CHF ₂	Ph	CI
Me	Me	н	н	2	н	н	CF ₃	Ph	н .
Me	Me	H	н	2	н	н	CF ₈	Ph	Ме
Me	Me	H	н	2	н	H	Me	Ph	CF ₃
Me	Me	н	н	2	H	H	CF ₃	Ph	Et
Me	Me	н	н	2	н	H	CF ₃	Ph	Pr-i
Me	Me	н	н	2	н	H	CF3	Ph	CHF ₂
Me	Me	H	н	2	H	Ħ	CF ₃	Ph	CF ₃
Me	Me	H	н	2	н	Ħ	CF ₈	Ph	F
Me	Me	H	н	2	н	H	CF3	Ph	C1
Me	Me	H	н	2	H	н	CI	Ph	CF ₈
Me	Me	н	н	2	H	H	CF ₃	Ph	он
Me	Me	н	н	2	H	H	он	Ph	CF ₃
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₈	Ph	ОМе
Me	Me	H	н	2	H	н	ОМе	Ph	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OEt
Me	Me	H	н	2	н	H	OEt	Ph .	CF ₃
Me	Me	H	н	2	н	H	CF ₃	Ph	OPr-i
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Ph	OPr
Me	Me	H	H	2	н	н	CF ₃	Ph	OBu-t
Me	Me	H	H	2	H	н	CF ₈	Ph	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OCH2CH=CH2
Me	Me	H	H	2	н	н	CF ₃	Ph	OCH ₂ C≡CH
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OCHF ₂
	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Ph	CF ₃
Me	Me	H	1	2	H	l	CF ₈	Ph	OCH ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	н	CF ₈	Ph	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ C(=O)OMe
Μe	Me	н	H	2	H	H	CF ₈	Ph	OCH(Me)C(=O)OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OC(Me) ₂ C(=O)OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Ph	OC(=O)Me
Me	Me	н	H	2	н	H	CF ₃	Ph	OC(=O)Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Ph	OC(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	н	н	2	н	н	CF ₃	Ph	OC(=O)CF ₃

ı.	1	,	,	,	,	,	1	1	•
1	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OC(=0)Ph
- 1	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	Н	H	CF ₃	Ph	SMe
Me	Me	H	н	2	Н	H	CF ₈	Ph	SOMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SO₂Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Ph	SEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SOEt
Me	Me	н	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Et
Me	Me	н	н	2	H	H	CF ₃	Ph	SP r i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF₃	Ph	SOPr-i
Me	Me	н	н	2	H	H	CF ₃	Ph	SO₂Pr-i
Me	Me	H	н	2	н	H	CF3	Ph	SPr
Me	Me	н	H	2	н	H	CF ₃	Ph	SOPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Pr
Me	Me	н	н	2	H	H	CF ₈	Ph	SBu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Ph	SOBu-t
Me	Ме	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Bu-t
Me	Ме	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SCHF ₂
Me	Ме	H	н	2	H	H	CF ₃	Ph	SOCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	NH2
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)2
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	н	н	2	H	H	CF ₃	Ph	NHSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	NHPh
Me	Me	H	н	2	H	1 1	CF ₈	Ph	N(Me)Ph
Me	Me	н	H	2	H		CF ₃	Ph	CN
!	Me		H	ı	н		CF ₃	Ph	C(=O)Me
1	Me	н	н	2	н		CF ₃	Ph	C(=0)OMe
1 1	, ,		1	- l	- 			-	5/52/20

Me	vr- 1	н	н	2	н	н	CF ₃	Ръ	C(=0)NH2
1 1			- 1	2	H		CF ₃	Ph	C(=O)NHMe
Me		H	H	i l				Ph	C(=O)N(Me) ₂
Ме		H	H	2	H		CF ₃	Ph	Imidazol-1-yl
Me	*	H	H	2	H		CF ₈	,	1
Me	1	H	H	2	H	j	CF ₃	Ph	Pyrazol-1-yl
Me	1	H	H	2	H		CF ₃	Ph	1,2,4-Triazol-1-yl
Me	- 1	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	1,2,4-Triazol-4-yl
Ме	1	H	H	2	H		CF ₈	Ph	Tetrazol·1-yl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	Tetrazol·5-yl
Ме	Me	H	H	2	н	H	CF3	Ph	(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)
Ме	Me	н	н	2	н	Ħ	CF ₃	Ph	(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl) sulfonyl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₂ CF ₃	Ph	Cl
Ме	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	(2·Cl)Ph	CI
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	(2-F)Ph	CI
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	(2-OMe)Ph	CI
Me	Me	н	н	2	Ħ	H	CF3	(2-Me)Ph	CI
Me	Me	H	н	2	H	H	CF3	(2·NO ₂)Ph	CI
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₈	(2-CN)Ph	Cı
Me	Me	H	н	2	H	H	CF3	(2-C(=O)Me)Ph	C1
Me	Me	н	H	2	H	H	CF ₃	(2-C(=O)OMe)Ph	CI
Me	Me	н	н	2	H	Н	CF3	(2-C(=O)OEt)Ph	CI
Me	Me	н	Н	2	H	H	CF ₃	(2-C(=0)OPr-i)Ph	CI
Me	Me	н	н	2	н	н	CF ₈	(2-C(=O)NH2)Ph	C1 ,
Me	Me	н	н	2	н	н	CF3	(2-C(=O)NHMe)Ph	CI
Me	Me	н	н	2	H	н	CF ₈	(2-C(=O)NMe ₂)Ph	C1
Me	Me	H	H	2	н	н	CF ₃	(3-Cl)Ph	C1
Me	Me	H	н	2	н	H	CF ₃	(3·F)Ph	C1
Me	Me	H	H	2	H	н	CF ₃	(3-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	н	CF ₃	(3-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	н	CF ₃	(3·NO ₂)Ph	CI
Me	Me	н	H	2	H	н	CF ₃	(3-CN)Ph	CI
Me	Me	н	H	2	H	H	CF ₃	(3-C(=O)Me)Ph	Cl
	Me	H	H	2	H	н	CF3	(3-C(=O)OMe)Ph	Cl
1	Me	н	H	1	H	н	CF ₈	(3-C(=O)OEt)Ph	Cı
1	Me	H	H	1	н	н	CF ₃	(3-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
1	Me	H	H		н	н	CF ₈	(3-C(=O)NH ₂)Ph	Cl
	Me	H	H	1	H	н	CF ₃	(3-C(=O)NHMe)Ph	Cı
1,110	J-"-C	1 **	1-4	1 ~	1	,	1	1	

l	L .	ì	1		1	1	1	1	1
1	Me	H	H	ŀ	H	H	CF ₈	(3-C(=O)NMe ₂)Ph	CI
1	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	(4-Cl)Ph	CI
	Me	H	H	2	Н	H	CF ₃	(4-F)Ph	CI
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-OMe)Ph	CI
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-Me)Ph	Cı
Me	Me	H	Н	2	H	н	CF ₃	(4-NO ₂)Ph	Cı
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-CN)Ph	C1
Me	Me	H	H	2	н	H	CF ₃	(4-C(=O)Me)Ph	Cı
Me	Me	H	H	2	н	H	CF ₃	(4-C(=0)OMe)Ph	Cı
Me	Me	H	Н	2	н	H	CF3	(4-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF3	(4-C(=0)OPr-i)Ph	C1
Me	Me	H	H	2	H	H	CF3	(4-C(=O)NH2)Ph	Cı
Me	Ме	H	H	2	H	H	CF3	(4-C(=O)NHMe)Ph	Cı
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-C(=O)NMe ₂)Ph	CI
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₈	P yrm idin-2-yl	Cı
1	Me	H	H	2	H	Ħ	CF ₈	4,6-Dimethoxypyrmidin-2-yl	Cı
1	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Thiophen-2-yl	CI
1	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Furan-2-yl	CI
1	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ Me	Cı
ł	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ Et	Cı
Me		H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ Pr-i	C1
Me		H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ CH ₂ Ph	CI
Me		H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ CHF ₂	Cı
Ме	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	SO ₂ CF ₃	C1
Ме	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ Ph	Cı
Ме	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=0)Me	Cı
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	C(=0)Et	C1
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=0)Pr-i	Cı
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	C(=0)Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=0)Ph	C1
Ме	Me	H	H	2	H	н	CF ₃	C(=0)CH₂Ph	C1
Ме	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	C(=0)CH₂Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=0)CHCl ₂	Cl
Ме	Me	H	н	2	H	н	CF ₃	C(=0)CF3	CI
Ме	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	C(=O)OMe	Cl
Ме	Me	H	H	2	н	H	CF ₃	C(=0)OPh	Cl
Ме	Me	H	н	2	н	H	CF ₈	C(=0)OCH ₂ Ph	Cl
Ме	Me	H	н	2	H	H	CF3	C(=0)NHMe	Cl

Ме	Me	H	н	2	н	н	CF ₈	C(=O)N(Me)2	Cı
Me	Me	н	н	2	н	H	CF ₈	C(=O)NHPh	CI
Ме	Me	H	H	2	н	H	CF3	NH2	C1
Ме	Me	H	н	2	н	H	Cl	-(0	H ₂) ₂ O·
Ме	Me	н	н	2	н	H	Cl	(C	CH2)3O-
Ме	Me	H	н	2	н	H	Cl	-(0	CH2)3S-
Ме	Me	н	н	2	н	Ħ	Cl	-(CI	H ₂) ₃ SO ₂ -
Ме	Me	H	н	2	Нs	H	CF3	-(c	.H₂)₂O-
Ме	Me	н	н	2	н	н	CF3	-(c	CH2)8O-
Ме	Me	H	н	2	н	H	CFs	-(c	CH2)8S-
Ме	Ме	H	н	2	н	H	CF ₈	-(CI	H ₂) ₈ SO ₂ -
Me	Me	H	н	2	н	Ħ	ОМе	-(CH ₂) ₄ -
Me	Ме	H	H	2	н	H	OCHF2	-(CH ₂)4-
H	н	H	н	2	н	н	CF ₃	Me	C1
Me	н	H	н	2	н	H	CF ₃	Me	CI
Me	н	Me	н	2	H	H	CF3	Me	Cı
Me	Me	Me	н	2	H	H	CF ₈	Me	C1
Me	Ме	н	н	2	Me	H	CF ₃	Me	C1
Ме	Ме	H	н	2	Et	H	CFs	Me	Cı
Ме	Me	H	н	2	Pri	Ħ	CF ₈	Me	[C1
Me	Me	н	н	2	Me	Me	CF ₃	Me	CI
Me	Et	H	H	2	н	н	CF3	Me	CI
Et	Et	Ħ	н	2	H	H	CF ₈	Me	C1
Me	P r- i	H	H	2	н	н	CF ₃	Me	C1.
Me	Pr	H	H	2	н	H	CF ₃	Me	cı .
Me	Pr-c	н	н	2	H	H	CF ₃	Me	CI
Me	CH ₂ Pr-c	н	н	2	H	н	CF ₃	Me	CI
-((CH2)2-	H	н	2	H	н	CF ₈	Me	C1
-((CH ₂) ₃ -	H	н	2	H	н	CF ₃	Me	CI
-((CH ₂) ₄ -	H	H	2	н	н	CF ₈	Me	CI
-((CH ₂) ₅ -	н	H	2	H	н	CF ₃	Me	C1
H	-(CH	2)3-	н	2	H	н	CF ₈	Me	CI
H	-(CH	2)4-	н	2	H	н	CF ₈	Me	CI
н	-(CH	2)5-	H	2	H	н	CF ₈	Me	Cı
н	-(CH	2)6-	H	2	н	н	CF ₃	Me	C1
Me	Me	H	H	1	H	н	Cı	н	Cı
Me	Me	н	H	1	H	н	OCHF2	н	[C1
1	•	•	•	•	•	•	•	•	•

					_				
Me	Me	н	H	1	н	H	OCHF2	H	OCHF ₂
Me	Me	Н	H	1	H	H	CHF ₂	H	CI
Me	Me	н	H	1	H	H	CF ₈	H	F
Me	Me	H	H	1	H	н	CF ₃	н	CI
Me	Me	H	H	1	H	н	CF ₈	H	ОМе
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	H	OEt
Me	Me	H	H	1	H	н	CF ₃	H	OCHF2
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	H	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	н	Me
Me	Me	H	H	1	н	H	H	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Ме	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Me	CI
Me	Ме	н	H	1	H	H	C1	Me	Me
Ме	Me	н	H	1	H	H	Et	Ме	Cl
Ме	Me	H	H	1	H	H	Cı	Me	Et
Me	Me	H	H	1	H	H	Pri	Me	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	Pr-i
Ме		H	H	1	H	H	Bu-t	Ме	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	Cı	Ме	Bu•t
Me		H	H	1	H	H	Cl	Ме	C1
Ме	1	H	H	1	H	H	CHF ₂	Ме	CI
Ме		H	Н	i	H	H	CI	Me	CHF ₂
Ме	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Me	H
Me		H	H	1	H	H	OCHF2	Me	CI
Me	i i	Н	H	1	H	H	Cı	Ме	OCHF2
Ме		H	H	1	H	H	OCHF ₂	Me	OCHF ₂
Ме		H	H	1	H	H	CF ₃	Me	H
Me		H	H	1	H	H	CF ₃	Ме	C1
Me	Me	H	H	1	H	H	CI	Me	CF ₃
Me		H	H	1	H		CF ₃	Me ·	Ŧ
Ме		H	H	1	H	H	F	Me	CF ₃
Me	1	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OH
Ме		н	H	1	H	H	ОН	Me	CF ₃
Ме		H	H	1	H	H	CF ₃	Me	ОМе
Ме	T I	H	H	1	H	H	ОМе	Me	CF ₃
Ме	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Me	OEt
Ме	Me	H	H	1	H	H	OEt	Ме	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Me	OP r- i

Me Me	H	н	1	н	H	CF ₃	Ме	OPr
Me Me	H	н	1	H	H	CF ₃	Me	OBu-t
Me Me	H	н	1	н	H	CF ₈	Me	OBu-s
Me Me	H	н	1	н	H	CF ₃	Ме	OBu-i
Me Me	н	н	1	н	Ħ	CF ₈	Me ·	OBu
Me Me	H	н	1	Ħ	H	CF3	Ме	O(2-Pen)
Me Me	H	н	1	H	н	CF3	Ме	O(3-Pen)
Me Me	н	н	1	н	н	CF3	Ме	OPen-n
Ме Ме	H	н	1	н	H	CF ₃	Ме	O(2-Hex)
Me Me	н	н	1	н	H	CF ₃	Ме	O(3-Hex)
Me Me	H	н	1	н	H	CF3	Ме	OHex-n
Me Me	H	н	1	H	H	CF ₃	Ме	OPen-c
Me Me	H	н	1	H	H	CF ₈	Me .	OHex-c
Me Me	H	н	1	H	H	CF ₃	Ме	OCH ₂ P ₁ -c
Me Me	н	н	1	H	H	CF3	Me	OCH₂Bu-c
Me Me	H	н	1	н	H	CF3	Ме	OCH ₂ Pen-c
Ме Ме	H	н	1	H	H	CF3	Ме	OCH ₂ Hex·c
Me Me	H	H	1	н	н	CF ₃	Me	OCH ₂ CH=CH ₂
Me Me	H	н	1	н	H	CF3	Me	OCH₂C≡CH
Ме Ме	H	н	1	н	н	CF ₃	Me	OCHF ₂
Me Me	H	H	1	н	H	OCHF2	Me .	CF ₃
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CHF ₂
Me Me	н	H	1	н	H	OCH ₂ CHF	Ме	CF ₃
Me Me	H	н	1	H	H	CF3	Me	OCH ₂ CF ₃
Ме Ме	н	н	1	н	H	OCH ₂ CF ₃	Ме	CF ₈
Me Me	н	н	1	н	H	CFs	Me	OCH ₂ CN
Me Me	н	H	1	H	H	CF ₃	Ме	OCH2C(=O)OEt
Me Me	н	н	1	H	H	CF ₃	Ме	OCH(Me)C(=O)OEt
Me Me	н	н	1	H	H	CF3	Me	OCH ₂ C(=0)NH ₂
Me Me	H	н	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C(=0)NHM ₀
Me Me	H	н	1	H	H	CF ₃	Me ·	OCH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	ОСН₂РЬ
Me Me	н	н	1	H	H	CF3	Me	OPh
Me Me	н	H	1	H	H	CF8	Me	O(2-C1)Ph
Me Me	н	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(2-Br)Ph
Ме Ме	н	н	1	H	H	CF ₃	Ме	O(2-F)Ph
Me Me	H	н	1	н	н	CF ₈	Ме	O(2-Me)Ph

					_				
Me	Me	H	H	1	н	H	CF ₈	Me	O(2·OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(2·NO ₂)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Me	O(2-CN)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(2-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	н	1	H	H	CF3	Me	O(3-Cl)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(3-Br)Ph
Me	Me	H	Н	1	H	H	CF ₈	Me	O(3-F)Ph
Me	Me	H	H	1	н	H	CF3	Me	O(3·Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(3-OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Me	O(3·NO ₂)Ph
Me	Me	H	H	1	н	H	CF ₃	Me	O(3-CN)Ph
Ме	Me	H	н	1	н	H	CF ₃	Me	O(3-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	Н	1	н	H	CF ₃	Ме	O(4-Cl)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(4-Br)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ме	O(4-F)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(4-Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF3	Me	O(4-OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	н	CF ₃	Me	O(4-NO ₂)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Ме	O(4-CN)Ph
Ме	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(4-C(=O)OMe)Ph
Me		H	H	1	H	H	CF3	Ме	OC(=O)Me
Ме		H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)Et
Ме	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)CH₂Ph
Me		H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)CF ₃
Ме		H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)Ph
Me		H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OSO ₂ Me
Me		H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OSO₂Et
Me		H	H	1	H	H	CF ₃	Ме	OSO ₂ CH ₂ Ph
Ме		H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OSO ₂ CF ₃
Me		H	H	1	H	H	CF ₈	Me	OSO ₂ Ph
Me		H	H	1	H	H	CF ₃	Ме	SMe
Ме		H	H	1	H	H	CF ₃	Ме	SO ₂ Me
Me	1	H	H	1	H	H	CF ₃	Ме	SEt
Ме	ł	H	H	1	H	H	CF ₈	Ме	SO ₂ Et
Me	1	H	Ħ	1	H	H	CF ₃	Ме	SPr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ме	SO ₂ Pr
Ме	Me	н	H	1	H	H	CF ₈	Ме	SPr-i
Me	Me	H	H	1	н	н	CF ₈	Me	SO ₂ Pr-i

						_		
Me Me	H	н	1	H	H	CF ₈	Me	SBu-t
Me Me	H	н	1	н	H	CF ₈	Ме	SO ₂ Bu-t
Ме Ме	H	H	1	н	H	CF3	Me	SCHF ₂
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CHF ₂
Me Me	H	н	1	н	H	CF3	Me	SCF ₈
Me Me	н	H	1	н	H	CF3	Me	SO ₂ CF ₃
Me Me	H	н	1	н	H	CFs	Ме	SPh
Me Me	H	н	1	н	H	CF ₈	Me	SO ₂ Ph
Ме Ме	H	н	1	н	H	CF ₃	Me	SCH ₂ Ph
Me Me	H	H	1	H	H	CF3	Me	SO ₂ CH ₂ Ph
Me Me	H	H	1	н	H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=0)OEt
Me Me	н	н	1	н	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)OEt
Ме Ме	н	H	1	H	Ħ	CF ₃	Me	SCH(Me)C(=O)OEt
Me Me	н	H	1	н	H	CF3	Me	SO2CH(Me)C(=O)OEt
Me Me	н	H	1	H	H	CF3	Me	SCH ₂ C(=O)NH ₂
Me Me	н	н	1	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)NH ₂
Me Me	H	H	1	н	H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=0)NHMe
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=0)NHMe
Me Me	н	H	1	н	H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me Me	H	H	1	н	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me Me	н	H	1	н	H	CF ₃	Me	NH ₂
Me Me	H	H	1	н	н	CF ₈	Me	NHMe
Me Me	H	H	1	Ħ	H	CF ₈	Me	N(Me)2
Me Me	н	H	1	H	н	CF ₃	Me	NHC(=O)Me
Me Me	н	H	1	н	H	CF ₈	Me	N(Me)C(=O)Me
Me Me	н	н	1	H	н	CF ₃	Me	NHSO2Me
Me Me	н	H	1	H	н	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ Me
Me Me	н	H	1	H	H	CF ₈	Me	NHSO2CHF2
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me Me	н	H	1	H	H	CF ₃	Me	NHSO2CF3
Me Me	H	H	1	H	н	CF ₈	Me	N(Me)SO ₂ CF ₈
Me Me	H	H	1	H	н	CF ₃	Ме	NHPh
Me Me	H	H	1	н	н	CF ₈	Ме	N(Me)Ph
Me Me	н	н	1	н	H	CF ₃	Me	CN
Ме Ме	н	н	1	н	H	CN	Me	CF ₈
Me Me	H	H	1	н	H	CF ₈	Me	C(=O)OMe
Me Me	н	H	1	H	H	CF ₃	Me	C(=O)OCH₂Ph
Me Me	Н	Н	1	Н	н	CF ₃	Me	C(=O)OPh
1 1 1	1	, —	ı –	,	ı —	1	i	1

Me	Me	н	н	1	н	н	CF ₈	Me	C(=O)NH2
Me	Me	н	H	1	H	H	CF ₃	Me	C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	C(=O)N(Me)2
Me	Me	н	H	1	H	H	CF ₃	Ме	C(=O)Me
Me	Me	н	H	1	H	H	CF ₃	Me	C(=O)CF ₃
Me	Me	н	н	1	H	H	CF ₃	Ме	C(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	н	H	1	н	н	CF ₃	Me	C(=0)Ph
Ме	Me	н	н	1	H	H	CF ₃	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Me	Et
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₃	Me .	P r i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Pr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF3	Me	CH₂OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	н	H	CF ₃	Me	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Ph
Me	Ме	H	H	1	H	H	CF2CF3	Me	C1
Me	Me	H	н	1	H	H	Ph	Me	Ме
Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	C1
Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	CF ₃
Me	Ме	H	H	1	H	H	Ph	Me	Ph
Me	Me	H	н	1	H	H	CI	Et	C1
Me	i l	H	H	1	H	H	OCHF2	Et	C1
1	Me	H	H	1	H	H	Cl	Et	OCHF2
Me		H	H	1	H 	H	_	Et	OCHF2
Me		H	H	1	H	H	CF3	Et	F
Me	1	H	H	1	H		F	Et	CF ₃
Me		H	H	1	H	H	CF ₃	Et	C1
Me		H	H		H		Cl	Et	CF ₈
Me		H	H	-	H		CF ₃	Et L	OMe
Ме		H	1	1	i 1		ОМе	Et	CF ₃
Me		H		1	1		CF ₃	Et	OEt
Me	1	H	1				OEt	Et	CF ₃
Me	Į.	H	H		H		CF ₈	Et	OCHF2
Me			H		H		OCHF2	Et	CF ₃
Me		H	H	1	H	н	CF ₈	Et	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	Et	CF ₃

					-			·	
Me Me	1	ı	н	1	н	н	CF ₃	Et	Ме
Me Me	1	Ħ	H	1	н	H	Me	Et	CF ₃
Me Me] 1	a	н	1	н	H	Cl	Pr-i	C1
Me Me	1	a	н	1	н	н	OCHF ₂	Pr-i	Cı
Me Me	1	H	н	1	н	Ħ	Cl	Pr-i	OCHF ₂
Me Me]]	HI	н	1	н	H	OCHF2	Pr-i	OCHF2
Me Me]]	H	н	1	н	н	CF3	Pr-i	F
Me Me	1	H	н	1	н	H	F	P r- i	CF ₃
Me Me	1	H	H	1	н	H	CF ₃	Pr-i	cı .
Me Me	1	H	н	1	н	н	C1	Pr-i	CF ₈
Me Me	1	H	н	1	н	н	CF ₃	Pr-i	ОМе
Me Me] ;	H.	н	1	н	H	OMe	Pr-i	CF ₃
Me Me	1	н	н	1	н	H	CF3	Pr-i	OEt
Me Me	1	H	н	1	н	H	OEt	Pr-i	CIF ₈
Me Me	1	H	н	1	н	H	CF3	Pr-i	OCHF ₂
Me Me		н	н	1	н	H	OCHF2	Pr-i	CF ₈
Me Me	1	н	н	1	н	H	CF3	Pr-i	CN
Me Me	[]	H	н	1	H	H	CN	Pr-i	CF ₃
Me Me		H	н	1	H	н	CF ₃	Pr-i	Me
Me Me		Н	н	1	н	Ħ	Me	Pr-i	CF ₃
Me Me		Н	н	1	н	H	CI	Pr	C1
Me Me	[]	H	н	1	н	H	OCHF2	Pr	Cı
Me Me		H	н	1	H	H	Cı	Pr	OCHF ₂
Me Me		H	н	1	н	H	OCHF2	Pr	OCHF2
Me Me		H	H	1	н	н	CF3	Pr	F
Me Me	:	H	н	1	н	H	F	Pr	CF ₃
Me Me	. [:	H	н	1	н	H	CF ₃	Pr	CI
Me Me		H	н	1	н	H	CI	Pr	CF ₈
Me Me	. :	H	H	1	H	H	CF ₈	Pr	ОМе
Me Me	.]:	H	H	1	н	H	OMe	Pr .	CF ₈
Me Me		H	н	1	H	H	CF ₃	Pr	OEt
Me Me	. [H	H	1	H	H	OEt	Pr	CF ₃
Me Me	.]	H	н	1	H	H	CF ₃	Pr	OCHF ₂
Me Me		H	H	1	н	н	OCHF ₂	Pr	CF ₈
Me Me		н	H	1	H	н	CF ₃	Pr	CN
Me Me		н	н	1	H	н	CN	Pr	CF ₈
Me Me		H	н	1	H	н	CF ₃	Pr	Me
Me Me	l l	н	н	1	н	н	Me	Pr	CF ₈
			1	•	1	•		1	•

Me Me H H I I H H CI But CI Me Me Me H H I I H H COCHF2 But CI Me Me Me H H I I H H CF3 But CF3 Me Me H H I I H H CF3 But CF3 Me Me H H I I H H CF3 But CF3 Me Me H H I I H H CF3 But CF3 Me Me H H I I H H CF3 But CF3 Me Me H H I I H H CF3 But CF3 Me Me H H I I H H CF3 But CF3 Me Me H H I I H H CF3 But CF3 Me Me H H I I H H CF3 But CF3 Me Me H H I I H H CF3 But CF3 Me Me H H I I H H CF3 But CF3 Me Me H H I I H H CF3 But CF3 Me Me H H I I H H CF3 But CF3 Me Me H H I I H H CF3 But CF3 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 But CF5 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylbutyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me Me H H I I H H CF3 I-Methylpentyl CF3 Me Me Me H H I I H H CI I-Methylpentyl CF3 Me Me Me H H I I H H CI I-Methylpentyl CF3 Me Me Me H H I I H H CI I-Methylpentyl CF3 Me Me Me H H I I H H CI I-Methylpentyl C										
Me H H I H	Me	Me	н	н	1	Н	H	Cı	Bu-t	Cı
Me Me H H H H CFs Burt H Me Me H H H H CFs Burt Cl Me Me H H H H H H H H H CFs Burt CDMe Me Me H	Me	Me	H	H	1	н	н	OCHF2	Bu-t	Cı
Me Me H H H CFs But F Me Me H H H CFs But CI Me Me H H I H H CFs But CFs Me Me H H I H H CFs But CFs Me Me H H I H H CFs But CFs Me Me H H I H H CFs But CCN Me Me H H I H H CFs But CN Me Me H H I H H CFs But CN Me Me H H I H H CFs Bus CI Me Me H H I H H CFs	Me	Me	н	н	1	H	H	OCHF2	Bu-t	OCHF ₂
Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But OMe Me Me H H I I H H OME But CFs Me Me H H I I H H OEt But CFs Me Me H H I I H H CFs But OEt Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CFs But CFs Me Me H H I I H H CI But CFs Me Me H H I I H H CI But CFs Me Me H H I I H H CI I	Me	Me	H	H	1	Н	H	CF ₃	Bu-t	H
Me Me H H I H H CF3 But CF3 Me Me H H I H H CF5 But CCF3 Me Me H H I H H CF5 But CCF3 Me Me H H I H H CF5 But CCF3 Me Me H I H H CF5 But CCF3 Me Me H I H H CF5 But CCN Me Me H I H H CF5 But CCN Me Me H I H H CF5 But CCI Me Me H I H H CF3 Bui CCI Me Me H I I H CF3 Bui CCI	Me	Me	н	H	1	H	H	CF ₃	Bu-t	F
Me Me H H I H H CF3 Burt OMe Me Me H H I H H CF3 Burt OEt Me Me H H I H GCF3 Burt OCHF2 Me Me H I H H CF3 Burt OCHF2 Me Me H I H H CF3 Burt OCHF2 Me Me H H I H CF3 Burt OCHF2 Me Me H H I H CF3 Burt CN Me Me H H I H Me CF3 CI Me Me H H I H CGF3 Buri CGF3 Me Me H H I H CGF3 Buri CGF3 <tr< td=""><td>Me</td><td>Me</td><td>н</td><td>н</td><td>1</td><td>H</td><td>H</td><td>CF₈</td><td>Bu-t</td><td>CI</td></tr<>	Me	Me	н	н	1	H	H	CF ₈	Bu-t	CI
Me Me H H I H H CF3 But CF3 Me Me H H I H H CF3 But CCF3 Me Me H H I H H CF3 But CCN Me Me H H I H H CF3 But CCN Me Me H H H H CF3 But CCN Me Me H H H H CF3 But CCN Me Me H H H H CF3 But CCI Me Me H H H CF3 Buis CCF3 Me Me H H H CF3 Buis CCF3 Me Me H H H CF3 1-Methylbutyl CCI Me	Me	Me	н	н	1	H	H	CI	Bu-t	CF3
Me Me H H I H H CFs But OEt Me Me H H I H H CFs But OCHF2 Me Me H H I H H CFs But OCHF2 Me Me H H I H H CFs But CN Me Me H I I H H CFs But CRs Me Me H I I H GFs Buris CI Me Me H I I H CI Buris CI Me Me H H I H CFs Buris CI Me Me H H I H CFs Buris CI Me Me H H I H CI Buri	Me	Me	H	H	1	H	H	CF3	Bu-t	ОМе
Me Me H H I H H CEFs Burt CCFs Me Me H I H H CFs Burt CN Me Me H I H H CFs Burt CN Me Me H I I H H CFs Burt Me Me Me H I I H Me Burt CFs Me Me H I I H CFs Burs CI Me Me H I I H CI Burs CI Me Me H I I H CI Burs CI Me Me H H I H CI Buri CI Me Me H H I H CI Buri CI Me <td>Me</td> <td>Me</td> <td>H</td> <td>H</td> <td>1</td> <td>H</td> <td>н</td> <td>OMe</td> <td>Bu-t</td> <td>CF₃</td>	Me	Me	H	H	1	H	н	OMe	Bu-t	CF ₃
Me Me H H H H CF3 Bu-t CCN Me Me H <t< td=""><td>Me</td><td>Ме</td><td>н</td><td>H</td><td>1</td><td>н</td><td>н</td><td>CF3</td><td>Bu-t</td><td>OEt</td></t<>	Me	Ме	н	H	1	н	н	CF3	Bu-t	OEt
Me Me H	Me	Me	H	H	1	H	н	OEt	Bu•t	CF3
Me Me H H I H H CFs Bu-t Me Me Me H H I H H Me Bu-t CFs Me Me H H I H H CFs Bu-s CI Me Me H H I H H CI Bu-s CFs Me Me H H I H H CI Bu-s CI Me Me H H I H H CI Bu-s CI Me Me H H I H H CI Bu-i CI Me Me H H I H H CI Bu-i CI Me Me H H I H H CI Bu-i CI Me Me H H <	Me	Me	H	H	1	н	н	CF3	Bu-t	OCHF ₂
Me Me H H I H	Me	Me	н	H	1	н	н	CF ₃	Bu-t	CN
Me Me H H 1 H H CF3 Bu-s CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 Bu-i CCI Me Me H H 1 H H CCF3 Bu-i CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 Bu-i CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 Bu-i CCF3 Me Me H H 1 H H CCI Bu-i CCF3 Me Me H H 1 H H CCI Bu-i CCF3 Me Me H H H H H H H H H H H H CF3 1-Ethylpropyl CF3 CCF3 Me Me H H H H H	Me	Me	·H	H	1	н	н	CF ₃	Bu-t	Ме
Me Me H H I H H CF3 CF3 CF3 Me Me H H I H H CF3 Bu-i CF3 CF3 CF3 Me Me H H I H H CF3 Bu CI CF3 CF3 CF3 Me Me H H I H H CF3 I-Methylbutyl CI CF3 CF3 </td <td>Me</td> <td>Me</td> <td>н</td> <td>H</td> <td>1</td> <td>н</td> <td>н</td> <td>Me</td> <td>Bu-t</td> <td>CF3</td>	Me	Me	н	H	1	н	н	Me	Bu-t	CF3
Me Me H H 1 H H CF3 Bu-i CF3 Me Me H H 1 H H CF3 Bu CI Me Me H H 1 H H CF3 Bu CI Me Me H H 1 H H CF3 CI Methylbutyl CF3 Me Me H H 1 H H CF3 1-Methylbutyl CF3 Me Me H H 1 H H CI 1-Ethylpropyl CI Me Me H H 1 H H CF3 1-Pentyl CI Me Me H H 1 H H CF3 1-Methylpentyl CI Me Me H H 1 H H CI 1-Methylpentyl CF3 Me<	Me	Me	H	H	1	H	н	CF3	Bu-s	CI
Me Me H H 1 H H CF3 Bu CCI Me Me H H 1 H H CF3 Bu CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 CCF3 CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 CCF	Me	Me	H	H	1	H	н	Cı	Bu-s	CF ₃
Me Me H H 1 H H CF3 Bu CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 CCF3 Me Me H H 1 H H CCF3 CCF3 Me	Me	Me	H	н	1	H	н	CF ₃	Bu-i	CI
Me Me H H I H H CI Bu CF3 Me Me H H I H H CF3 1-Methylbutyl CCF3 Me Me H H I H H CCF3 1-Ethylpropyl CCF3 Me Me H H I H H CCF3 1-Pentyl CCF3 Me Me H I H H CCF3 1-Pentyl CCF3 Me Me H I H H CCF3 1-Methylpentyl CCF3 Me Me H H I H H CCF3 2-Ethylbutyl CCI Me Me H H I H H CCF3 3,3-Dimethylbutyl CCF3 Me Me H H I H H CI 3,3-Dimethylbutyl CCF3	Me	Me	H	H	1	H	H	Cı	Bu-i	CF ₃
Me Me H H I H H CF3 1-Methylbutyl CI Me Me H H I H H CI 1-Methylbutyl CF3 Me Me H H I H H CI 1-Ethylpropyl CF3 Me Me H H I H H CF3 1-Pentyl CI Me Me H I H H CF3 1-Methylpentyl CI Me Me H H I H H CF3 1-Methylpentyl CF3 Me Me H H I H H CF3 2-Ethylbutyl CI Me Me H H I H H CF3 3,3-Dimethylbutyl CI Me Me H H I H H CI 1-Me CF3 3,3-Dimethylbutyl	Me	Me	H	н	1	H	н	CF3	Bu	Cl
Me Me H H I H H CF3 Me Me H H I H H CF3 1-Ethylpropyl CCI Me Me H H I H H CCI CF3 Me Me H H I H H CCI CCF3 Me Me H H I H H CCF3 Me Me H H I H H CCF3 Me Me H H I H H CCF3 CCI Me Me H H I H H CCI I I Me Me Me I H H I I H I I I I I I I I I I I I I I I I I	Me	Me	H	H	1	H	H	cı	Bu	CF ₃
Me Me H H I H H CF3 1-Ethylpropyl Cl Me Me H H I H H Cl 1-Ethylpropyl CF3 Me Me H I H H CF3 1-Pentyl CF3 Me Me H I H H CF3 1-Methylpentyl Cl Me Me H I H H CI 1-Methylpentyl CF3 Me Me H I H H CF3 2-Ethylbutyl CI Me Me H H I H H CF3 3,3-Dimethylbutyl CI Me Me H H I H H CI 3,3-Dimethylbutyl CF3	Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	1-Methylbutyl	CI.
Me Me H H I H H CI 1-Ethylpropyl CF3 Me Me H H I H H CI 1-Pentyl CF3 Me Me H I H H CF3 1-Methylpentyl CI Me Me H I H H CI 1-Methylpentyl CF3 Me Me H I H H CF3 2-Ethylbutyl CI Me Me H H I H CF3 3,3-Dimethylbutyl CI Me Me H H I H CI 3,3-Dimethylbutyl CF3	Me	Me	H	н	1	H	H	Cl	1-Methylbutyl	CF ₈
Me Me H H I H H CF3 1-Pentyl Cl Me Me H H I H H CF3 Me Me H H I H H CI Me Me H H I H H CF3 Me Me H H I H H CF3 2-Ethylbutyl CF3 Me Me H H I H H CF3 3,3-Dimethylbutyl CI Me Me H H I H H CF3 3,3-Dimethylbutyl CF3	Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₃	1-Ethylpropyl	C1
Me Me H H I H H CI 1-Pentyl CF3 Me Me H H I H H CF3 1-Methylpentyl CF3 Me Me H H I H H CF3 2-Ethylbutyl CI Me Me H H I H H CF3 3,3-Dimethylbutyl CI Me Me H H I H H CI 3,3-Dimethylbutyl CF3	Me	Me	H	H	1	H	H	CI	1-Ethylpropyl	CF ₃
Me Me H H H H CF3 1-Methylpentyl Cl Me Me H H 1 H H CF3 CF3 Me Me H H 1 H H CF3 2-Ethylbutyl CI Me Me H H 1 H H CF3 3,3-Dimethylbutyl CI Me Me H H H H H CF3 3,3-Dimethylbutyl CF3	Ме	Me	H	н	1	H	H	CF ₃	1-Pentyl	Cı
Me Me H H I H H CI 1-Methylpentyl CF3 Me Me H H I H H CF3 2-Ethylbutyl CI Me Me H H I H H CF3 3,3-Dimethylbutyl CI Me Me H H I H H CI 3,3-Dimethylbutyl CF3	Me	Me	H	H	1	H	H	CI	1-Pentyl	CF ₃
Me Me H H I H H CF3 2-Ethylbutyl Cl Me Me H H I H H CF3 2-Ethylbutyl CF3 Me Me H H I H H CF3 3,3-Dimethylbutyl CI Me Me H H I H H CI 3,3-Dimethylbutyl CF3	Me	Me	H	H	1	H	Н	CF ₈	1-Methylpentyl	C1
Me Me H H I H CI 2-Ethylbutyl CF3 Me Me H H I H H CF3 3,3-Dimethylbutyl CI Me Me H H I H H CI 3,3-Dimethylbutyl CF3	Me	Me	H	H	1	H	H	C1	1-Methylpentyl	CF ₃
Me Me H H 1 H CF3 3,3 Dimethylbutyl Cl Me Me H H 1 H Cl 3,3 Dimethylbutyl CF3	Me	Me	H	H	1	H	H	CF3	2-Ethylbutyl	Cl
Me Me H H 1 H Cl 3,3·Dimethylbutyl CF3	Ме	Me	H	H	1	H	H	C1	2-Ethylbutyl	CF ₃
	Me	Me	H	H	1	H	H	CF3	3,3-Dimethylbutyl	C1
MalMa H H I H H CEa 1-How)	Ме	Ме	H	H	1	H	H	Cl	3,3·Dimethylbutyl	CF ₃
Inches In in it in one in may in	Ме	Me	H	H	1	H	н	CF3	1-Hexyl	CI
Me Me H H 1 H H Cl 1-Hexyl CF3	Ме	Me	H	H	1	H	н	Cl	1-Hexyl	CF3
Me Me H H 1 H CF3 1. Heptyl Cl	Ме	Me	H	н	1	H	н	CF3	1·Heptyl	C1
Me Me H H 1 H H Cl 1-Heptyl CF3	Me	Me	н	H	1	H	н	Cl	1-Heptyl	CF3
Me Me H H I H H CF3 1-Octyl Cl	Me	Me	н	н	1	н	н	CF3	1-Octyl	CI CI

ls.	L . 1		I I	ا ـ ا	l 1	l	اس	ا ما	lan
1	Me	H	H		H	l	Cl	1-Octyl	CF ₃
1	Me	H	H		H	H	CF ₃	CH₂Ph	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	C1	CH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Ή	H	CF ₃	Pr-c	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Pen-c	CI
Me	Me	H	H	1	н	H	Cl	Pen·c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Hex-c	CI
Me	Me	H	н	1	н	н	Cı	Нех-с	CF ₃
Me	Me	H	н	1	н	H	C1	CH ₂ Pr-c	Cı
Me	Me	H	H	1	Ħ	H	OCHF2	CH ₂ Pr-c	Cı
Me	Me	H	н	1	н	H	Cı	CH₂Pr-c	OCHF2
Me	Me	H	H	1	н	Ħ	OCHF2	CH₂Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₃	CH₂Pr-c	F
Me	Me	H	н	1	H	н	F	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	н	H	CF3	CH2Pr-c	Cı
Me	Me	H	н	1	н	H	Cl	CH₂Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₃	CH ₂ Pr·c	CN
Me	Me	H	н	1	н	н	CF ₃	CH ₂ Pr-c	он
Me	Me	H	н	1	н	н	CF3	CH ₂ Pr-c	ОМе
Me	Me	H	н	1	H	H	ОМе	CH ₂ Pr-c	CF ₈
Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OEt
Me	Me	H	н	1	н	H	OEt	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OPr-i
Me	Me	H	н	1	н	H	CF3	CH ₂ Pr-c	OPr
Ме	Me	H	н	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OBu-t
Me	Me	H	н	1	н	H	CF3	CH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OCH ₂ Bu·c
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₈	CH ₂ Pr-c	OPen-c
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OCHF2
Me	Me	H	н	1	н	H	OCHF2	CH2Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	CN
Me	Me	H	н	1	H	H	CN	CH2Pr-c	CF ₈ ·
Me	Me	н	н	1	н	H	CF ₈	CH₂Pr-c	Me
Me	Me	H	н	1	н	H	Me	CH₂Pr-c	CF ₃
	Me	H	н	1	H	H	CF ₈	1-cyclopropylethyl	Cı
	Me	н	н	1	н	н	Cı	1-cyclopropylethyl	CF ₈
	Me	н	н	1	н	н	CF ₈	CH ₂ (2-Methyl-cyclopropyl	CI
Litte	1.446	41		1	11	11	J. 8	D .	

Me	Me	н	Н	1	н	н	CI	CH ₂ (2-Methyl-cyclopropy)	CFs
Me	Me	н	H	1	H	н	CF ₈	CH ₂ (2,2-Dimethyl-cyclops opyl)	CI
Me	Me	н	H	1	H	н	CI	CH ₂ (2,2-Dimethyl-cyclopropyl)	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH2(2-Chloro-cyclopropyl	Cı
Me	Me	H	H	1	H	H	Cı	CH2(2-Chloro-cyclopropyl)	CF ₈
Me	Me	н	H	1	H	H	CF3	CH ₂ (2,2-Dichloro-cyclopropyl)	Cı
Me	Me	н	H	1	н	н	C1	CH ₂ (2,2-Dichloro-cyclopropyl)	CF ₈
Me	Me	H	H	1	Н	H	CF ₃	CH2(2-Fluoro-cyclopropyl)	Cı
Me	Me	н	H	1	H	н	Cı	CH2(2-Fluoro-cyclopropyl)	CF ₃
Me	Ме	н	н	1	н	н	CF ₃	CH ₂ (2,2-Difluoro cyclopropyl)	CI
Me	Ме	H	H	1	H	н	Cl	CH ₂ (2,2-Difluoro cyclopropyl)	CF ₃
Me	Me	н	н	1	H	н	CF ₃	CH ₂ Bu-c	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	CI	CH ₂ Bu-c	CF ₈
Me	Me	H	Н	1	H	н	CF ₃	CH ₂ Pen-c	CI CI
Me	Me	H	H	1	H	H	C1	CH ₂ Pen-c	CF ₃
Ме	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Hex-c	Cı
Me	Me	H	H	1	H	H	Cı	CH ₂ Hex-c	CF3
Me	Me	H	H	1	H	н	CF ₃	CH ₂ CH ₂ Pr-c	C1
Ме	Me	H	H	1	H	H	C1	CH2CH2Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	н	CF3	CH ₂ CH=CH ₂	C1
Ме	Me	H	H	1	н	H	CI	CH ₂ CH=CH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	н	CF ₃	CH₂CH=CHCl	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CI	CH2CH=CHC1	CF ₃
Ме	Me	H	н	1	H	H	CI	CH ₂ C≡CH	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CH ₂ C≡CH	Cl
Ме	Me	H	H	1	H	H	CI	CH₂C≡CH	OCHF ₂
Ме		H	H	1	H	H	OCHF ₂	CH ₂ C≡CH	OCHF ₂
Ме	Ме	H	H	1	H	H	CF ₈	CH ₂ C≡CH	F
Ме	Me	H	H	1	H	H	F	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Ме	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	CH ₂ C≡CH	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ C≡CH	CF ₈
Me	M/e	H	н	1	н	н	CF ₈	CH₂C≡CH	ОМе
Me	Me	Ħ	H	1	H	н	ОМе	CH₂C≡CH	CF ₈
Me	Me	H	н	1	н	н	CF ₃	CH₂C≡CH	OEt
Me	Me	H	н	1	H	н	OEt		CFs
Me	Me	H	H	1	н	н	CF8		OCHF2

							•		
Me	Me	н	н	1	н	н	OCHF2	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	н	H	CF3	CH₂C≡CH	CN
Me	Me	H	н	1	H	н	CN	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me	Me	H	н	1	H	H	CF3	CH ₂ C≡CH	Me
Me	Me	н	н	1	н	н	Me	CH ₂ C≡CH	CF ₈
Me	Me	H	н	1	н	н	CF3	CHMeC≡CH	C1
Me	Me	H	н	1	н	H	Cl	CHMeC≡CH	CF ₈
Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₈	CH ₂ C≡ <i>C</i> Me	Cì
Me	Me	H	н	1	H	H	Cı	CH ₂ C≡CMe	CF ₈
Me	Me	H	н	1	H	H	CI	CHF ₂	CI
Me	Me	H	н	1	H	H	OCHF2	CHF ₂	C1 .
Me	Me	H	H	1	H	H	CI	CHF ₂	OCHF2
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF2	CHF ₂	OCHF ₂
Ме	Me	H	н	1	H	H	CF ₈	CHF ₂	C1
Me	Ме	H	H	1	H	H	Cı	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₈	CHF ₂	F
Me	Me	H	н	1	H	H	F	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	CHF ₂	ОМе
Me	Me	H	H	1	н	H	ОМе	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CHF ₂	OEt
Me	Me	Ħ	H	1	H	H	OEt	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CHF ₂	OCHF2
Me	Ме	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	Н	CF3	CHF ₂	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	н	н	CF ₃	CHF ₂	Me
Me	Me	H	н	1	H	H	Me	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	CHF ₂	CI
Me	Me	H	H	1	H	н	CI	CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	н	H	Et	CHF ₂	C1
Me	Me	H	H	1	н	н	Cl	CHF ₂	Et
Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	C1
Me	Me	H	н	1	H	H	Cı	CH2CHF2	CF ₈
Me	Me	H	H	1	н	H	CF ₃	CH ₂ CF ₈	CI
Me	Ме	H	H	1	Н	H	Cı	CH ₂ CF ₃	CF ₈
Me	Me	H	H	1	н	н	CF ₃	CH₂OH	C1
Me	Me	н	H	1	н	н	Cì	CH ₂ OH	CF ₃
Me	Me	н	H	1	н	н	Cı	CH ₂ OMe	Cl
•	•	•	•	•	•	•	•	•	•

			_						
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	Ci
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ OMe	OCHF2
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF2	CH₂OMe	OCHF2
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH₂OMe	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	CH₂OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH₂OMe	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	CI	CH₂OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF3	CH₂OMe	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	ОМе	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	н	CF ₃	CH ₂ OMe	OCHF2
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF2	CH₂OMe	CF ₈
Me	Me	H	H	1	H	H	CF3	CH ₂ OMe	CN
Ме	Me	H	H	1	H	H	CN	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	CH ₂ OMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	н	Ме	CH ₂ OMe	CF ₃
Ме	Me	H	H	1	H	н	CF ₈	CH ₂ OEt	Cı
Me		H	H	1	H	H	CI	CH ₂ OEt	CF ₈
Me		H	H	1	н	H	CF ₈	CH ₂ CH ₂ OH	CI
Me		H	H	1	H	H	CI	CH₂CH₂OH	CF ₃
Me		H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OMe	CI
Me		H	H	1	H	H	CI	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
Me		H	H	1	H	H	CF ₃	CH2CH2OEt	CI
Ме		H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OEt	CF ₈
Me		H	H	1	H	H	CF ₃	CH2NHMe	CI
Me		H	H	1	H	H	Cl	CH2NHMe	CF ₈
Me		H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ N(Me) ₂	C1
Me	Me	H	ᄪ	1	H	H	CI	CH ₂ N(Me) ₂	CF ₈
Me		H	H	1	H	H	CF ₈	CH ₂ N(Me)C(=O)Me	CI
Me		H	H	1	H	H	Cl	CH2N(Me)C(=O)Me	CF ₃
Me]	ı	H	H	1	н	H	CF ₃	CH2N(Me)C(=O)CF3	CI
Me	1	H	H	1	H	H	Cl	CH2N(Me)C(=0)CF ₃	CF ₃
Me 1	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	C1
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH2N(Me)SO2Me	CF ₈
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	CH2N(Me)SO2CHF2	Cı
Me	Me	H	H	1	н	H	Cl	CH2N(Me)SO2CHF2	CF ₃
Me	Me	H	H	1	н	H	CF ₃	CH2N(Me)SO2CF8	C1

Me Me	н	н	1	н	н	Cı	CH2N(Me)SO2CF3	CF ₃
Me Me	н	н	1	н	н	CF ₃	CH ₂ SMe	CI
Ме Ме	н	H	1	H	н	Cı	CH ₂ SMe	CF ₃
Ме Ме	н	н	1	Ħ	H	CF ₃	CH ₂ SO ₂ Me	CI
Ме Ме	H	н	1	H	H	Cl	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃
Ме Ме	H	H	1	н	H	CF₃	CH ₂ CH ₂ SMe	Cl
Me Me	H	н	1	Ħ	н	C1	CH ₂ CH ₂ SMe	CF ₃
Ме Ме	н	н	1	н	H	CF ₈	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Cl
Ме Ме	н	н	1	н	н	Cı	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃
Ме Ме	H	н	1	н	H	CF ₈	CH₂CN	Cı
Me Me	н	н	1	H	H	Cl	CH₂CN	CF ₃
Ме Ме	H	н	1	н	н	CF ₃	CH ₂ C(=O)OMe	CI
Ме Ме	н	н	1	н	н	Cı	CH ₂ C(=O)OMe	CF ₃
Me Me	H	н	1	н	н	CF ₃	CH ₂ C(=O)OEt	Cl
Me Me	H	н	1	н	н	C1	CH ₂ C(=O)OEt	CF ₃
Me Me	н	н	1	н	н	CF ₃	CH(Me)C(=O)OMe	Cl
Ме Ме	н	н	1	н	н	Cl	CH(Me)C(=O)OMe	CF ₈
Me Me	H	н	1	н	н	CF ₃	C(Me) ₂ C(=O)OMe	Cl
Ме Ме	H	н	1	н	H	Cl	C(Me) ₂ C(=O)OMe	CF ₃
Me Me	H	н	1	н	н	CF ₃	CH ₂ C(=O)NH ₂	Cl
Ме Ме	н	н	1	н	н	Cl	CH ₂ C(=O)NH ₂	CF ₃
Me Me	н	н	1	н	н	CF ₃	CH₂C(=O)NHMe	Cl
Ме Ме	н	H	1	H	н	Cl	CH₂C(=O)NHMe	CF ₃
Me Me	н	н	1	H	н	CF ₃	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	CI
Ме Ме	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	CF ₈
Ме Ме	H	H	1	н	H	CF ₃	CH₂C(=O)Me	Cı
Me Me	H	H	1	H	H	Cl	CH₂C(=O)Me	CF ₃
Ме Ме	н	H	1	H	н	CF ₃	CH₂C(=NOMe)Me	CI
Ме Ме	H	н	1	н	н	Cl	CH₂C(=NOMe)Me	CF ₃
Me Me	H	H	1	н	н	CF ₈	CH₂C(=O)CF ₈	C1
Me Me	H	H	1	H	н	CI	CH ₂ C(=O)CF ₃	CF ₈
Ме Ме	н	н	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(=O)Me	Cl
Me Me	н	H	1	H	H	CI	CH ₂ CH ₂ C(=O)Me	CF ₈
Me Me	н	н	1	H	H	Me	Ph	Me
Me Me	н	H	1	н	н	Me	Ph	Cı
Me Me	н	н	1	H	н	Et	Ph	(C1
Me Me	H	н	1	H	н	Pr	Ph	Cı
Me Me	н	н	1	H	н	Pr-i	Ph	CI
, ,	•	1	1	ı	•	1	1 .	•

	, ,							1	
Me	Me	H	H	1	H	H	Bu-t	Ph	CI
Me	Me	H	H	1	H.	H	CH ₂ OMe	Ph	CI
Me	Me	H	H	1	н	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	Н	H	OCHF2	Ph	C1
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF2	Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CHF2	Ph	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	H
Me	Ме	H	н	1	H	H	CF ₃	Ph	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Ph	CF ₃
Me	Me	H	н	1	H	H	CF3	Ph	Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF3	Ph	CHF2
Me	Me	H	H	1	H	H	CF3	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Ph	F
Me	Me	H	Ħ	1	H	H	CF3	Ph	Cı
Me	Me	H	H	1	H	H	CI	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	ОН
Me	Me	H	H	1	H	H	он	Ph	CF ₃
Me	Me	H	н	1	H	н	CF ₃	Ph	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	ОМе	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	Ph	CF ₈
Me	Me	H	H	1	H	H	CF3	Ph	OPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OPr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Ph	OBu-t
Me	Me	Ħ	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF3	Ph	OCH2CH=CH2
1	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ C≡CH
	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OCHF ₂
Me	1 1	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Ph	CF ₃
1	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OCH₂CHF₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ CF ₈
1	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Ph	OCH ₂ C(=O)OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OCH(Me)C(=0)OMe
Ме	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OC(Me)₂C(=0)OMe
Me	Me	H	н	1	H	н	CF ₃	Ph	OC(=O)Me
Ме	Ме	H	H	1	H	H	CF ₈	Ph	OC(=O)Et
Ме	Ме	Ħ	н	1	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)CH ₂ Ph

Me Me	н	н	1	н	H	CF3	Ph	OC(=O)CF ₃
Me Me	н	н	1	н	H	CF3	Ph	OC(=O)Ph
Me Me	н	н	1	н	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Me
Me Me	н	н	1	н	H	CF ₈	Ph	OSO ₂ Et
Me Me	H	H	1	н	H	CFs	Ph	OSO ₂ CH ₂ Ph
Me Me	н	H	1	н	н	CF ₈	Ph	OSO ₂ CF ₈
Me Me	н	н	1	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Ph
Me Me	н	H	1	H	Н	CF ₈	Ph	SMe
Me Me	н	H	1	H	H	CF ₃	Ph ·	SO ₂ Me
Me Me	н	H	1	н	H	CF ₈	Ph	SEt
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Et
Me Me	н	н	1	н	H	CF ₈	Ph	SPr-i
Me Me	H	н	1	H	H	CF ₃	Ph ·	SO ₂ Pr-i
Me Me	н	H	1	Ħ	H	CF ₈	Ph	SPr
Me Me	н	н	1	H	H	CF ₈	Ph	SO ₂ Pr
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SBu-t
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Ph .	SO ₂ Bu-t
Me Me	н	H	1	н	H	CF ₃	Ph	SCHF ₂
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ CHF ₂
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	NH2
Me Me	н	H	1	H	H	CF ₃	Ph	NHMe
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	N(Me) ₂
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	NHC(=O)Me
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)C(=O)Me
Me Me	H	H	1	H	Н	CF ₃	Ph	NHSO ₂ Me
Ме Ме	H	H	1	H	H	CF ₈	Ph	N(Me)SO ₂ Me
Me Me	H	H	1	н	H	CF ₃	Ph	NHSO ₂ CF ₃
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	NHPh
Ме Ме	H	H	1	H	H	CF ₈	Ph	N(Me)Ph
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	CN
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Ph	C(=O)Me
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)OMe
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)NH ₂
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)NHMe
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Ph	C(=O)N(Me) ₂
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Ph	Imidazol-1-yl
Me Me	H	H	1	н	н	CF3	Ph	Pyrazol-1-yl

Me	Me	H	H	1	н	н	CF ₃	Ph	1,2,4-Triazol-1-yl
Me	Me	H	H	1	H	Н	CF ₃	Ph	1,2,4-Triazol-4-yl
Ме	Me	H	н	1	н	н	CF ₃	Ph	Tetrazol-1-yl
Me	Me	H	H	1	н	н	CF ₃	Ph	Tetrazol-5-yl
Me	Me	н	н	1	н	н	CF ₃	Ph	(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)oxy
Me	Me	н	н	1	н	н	CF3	Ph	(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)sulfonyl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₂ CF ₈	Ph	CI
Me	Me	H	Н	1	Н	H	CF ₃	(2-Cl)Ph	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(2-F)Ph	CI
Me	Me	H	H	1	н	H	CF ₃	(2-OMe)Ph	C1
Me	Me	H	H	1	н	H	CF ₃	(2-Me)Ph	CI
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₃	(2-NO ₂)Ph	CI
Me	Me	H	H	1	н	H	CF3	(2-CN)Ph	cı .
Me	Me	H	н	1	н	н	CF ₃	(2-C(=O)Me)Ph	CI
Me	Me	H	н	1	н	н	CF ₈	(2-C(=O)OMe)Ph	C1
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₃	(2-C(=O)OEt)Ph	CI
Me	Me	H	н	1	H	н	CF ₃	(2-C(=0)OPr-i)Ph	CI
Me	Me	H	H	1	н	H	CF ₃	(2-C(=O)NH ₂)Ph	CI.
Me	Me	H	н	1	н	н	CF ₈	(2-C(=O)NHMe)Ph	C1
Me	Me	H	н	1	H	н	CF3	(2-C(=O)NMe ₂)Ph	Cı
Me	Me	H	н	1	н	н	CF ₈	(3-Cl)Ph	C1
Me	Me	н	н	1	H	н	CF ₃	(3-F)Ph	CI
Me	Me	H	н	1	H	н	CF3	(3-OMe)Ph	C1
Me	Me	H	H	1	H	н	CF ₃	(3-Me)Ph	C1
Me	Me	н	H	1	H	н	CF ₃	(3-NO ₂)Ph	C1
Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₈	(3-CN)Ph	C1
Ме	Me	H	н	1	н	H	CF ₃	(3-C(=O)Me)Ph	C1
Ме	Me	H	н	1	H	н	CF ₃	(3-C(=0)OMe)Ph	C1
Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₃	(3-C(=O)OEt)Ph	C1 ·
Me	Me	H	н	1	н	н	CF ₃	(3-C(=O)OPr-i)Ph	C1
Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₈	(3-C(=O)NH ₂)Ph	cı
Me	Me	н	н	1	н	н	CF ₈	(3-C(=O)NHMe)Ph	Cı
	Me	н	н	1	н	н	CF ₃	(3-C(=O)NMe ₂)Ph	C1
Me	1 1	н	H	1	H		CF ₈	(4-C1)Ph	Cl
Me		H	H	1	H		CF ₃	(4-F)Ph	Cl
Ме		H	H	1	H		CF ₈	(4-OMe)Ph	cı .
Me		H	H	1	н		CF ₃	(4-Me)Ph	Cl
1			**	1			1020	\ a ===================================	l~•

4	
•	

						-			
Me	Ме	H	н	1	н	H	CF ₃	(4-NO2)Ph	CI
Me	Me	H	H	1	н	н	CF3	(4-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₈	(4-C(=0)Me)Ph	[CI
Me	Ме	H	H	1	н	H	CF ₃	(4-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	н	1	н	Ħ	CF3	(4-C(=O)OEt)Ph	Cı
Ме	Me	H	Ħ	1	н	H	CF ₃	(4-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₃	(4-C(=0)NH2)Ph	CI
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₈	(4-C(=0)NHMe)Ph	C1
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₃	(4-C(=O)NMe ₂)Ph	CI
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₈	Pyrmidin-2-yl	Cl
Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₃	4,6-Dimethoxypyrmidin-2-yl	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Thiophen-2-yl	CI
Me	Me	H	H	1	н	H	CF ₃	Furan-2-yl	Cl
Me	Me	H	н	1	H	H	CF3	SO₂Me	Cl
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₈	SO₂Et	C1
Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₃	SO ₂ Pr-i	CI
Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₈	SO ₂ CH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	н	н	CF ₃	SO ₂ CHF ₂	CI
Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₃	SO ₂ CF ₃	CI
Me	Ме	H	H	1	н	H	CF ₈	SO ₂ Ph	C1
Me	Me	H	н	1	н	H	CF ₈	C(=O)Me	CI
	Me	H	H	1	н	H	CF3	C(=O)Et	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	C(=O)Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	C(=O)Bu-t	CI
Me	Me	н	H	1	H	H	CF ₈	C(=O)Ph	CI.
Me	Me	н	н	1	н	H	CF ₃	C(=O)CH ₂ Ph	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	C(=O)CH ₂ Cl	CI
Me	Me	н	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)CHCl2	CI
Me	Me	H	H	1	H	н	CF ₃	C(=O)CF ₃	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	C(=O)OMe	CI
Me	Me	н	н	1	н	н	CF ₃	C(=O)OPh	CI
Me	Me	н	н	1	H	н	CF ₈	C(=O)OCH ₂ Ph	C1
Me	Me	н	H	1	H	н	CF ₈	C(=O)NHMe	Cı
Me	Me	н	н	1	H	н	CF ₃	C(=O)N(Me)2	Cı
Me	Me	н	н	1	н	н	CF ₈	C(=O)NHPh	C1
Me	Me	н	н	1	H	н	CF ₃	NH₂	Cl
Me	Me	н	Н	1	н	н	Cl	-(0	CH ₂) ₂ O-
	Me	н	н	1	н	н	Cı	-(c	CH2)8O-
1	1	1	1	1	1	J	I	I	į

Me	Me	н	: н	1	н	н	cı		(CH₂)₃S-
Me	Me	H	: н	1	н	Н	Cı	٠((CH ₂) ₃ SO ₂ -
Me	Me	H	Н	1	н	H	CF ₃		(CH ₂) ₂ O-
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	-((CH₂)₃O·
Me	Me	н	н	1	H	H	CF ₃	-	(CH ₂) ₃ S·
Me	Me	н	H	1	H	н	CF ₃	-(0	CH ₂) ₈ SO ₂ -
Me	Me	H	н	1	H	н	OMe		·(CH ₂) ₄ ·
Me	Me	н	н	1	н	H	OCHF2		·(CH ₂) ₄ ·
н	н	H	н	1	н	н	CF ₃	Me	Cl
Me	н	н	н	1	H	н	CF ₃	Me	cı
Me	H	Me	н	1	н	H	CF ₃	Ме	C1
Me	Me	Me	H	1	H	H	CF ₈	Me	Cl
Me	Me	н	H	1	Me	H	CF ₈	Ме	CI
Me	Me	н	н	1	Et	H	CF3	Me	Cl
Me	Me	н	н	1	Pr-i	н	CF3	Me	Cı
Me	Me	н	н	1	Me	Me	CF ₈	Ме	Cı
Me	Et	н	н	1	H	н	CF ₃	Me	Cl
Et	Et	н	н	1	H	H	CF ₈	Me	CI
Me	Pr-i	н	н	1	H	H	CF3	Me	CI
Me	Pr	Н	H	1	H	н	CF3	Me	CI
Me	Pr-c	н	H	1	H	H	CF ₃	Me	CI
Me	CH ₂ Pr-c	н	н	1	H	H	CF ₃	Ме	CI
1 -	(CH ₂) ₂ -	н	H	1	H	H	CF ₃	Me	CI
•	(CH ₂) ₃ -	H	H	1	H	H	CF ₈	Ме	CI
1 -	(CH ₂) ₄ .	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
	(CH ₂) ₅ -	H	H	1	н	H	CF ₃	Me	Cı
H	-(CH	2)3-	H	1	н	H	CF ₃	Me	Cl
H	-(CH	2)4-	H	1	H	H	CF ₃	Ме	Cl
H	-(CH	2)5-	H	1	H	H	CF3	Ме	CI
H	-(CH	2)6-	H	1	H	H	CF ₃	Me	CI
Me	Ме	H	H	0	H	H	Cl	н	Cı
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF2	н	CI
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF2	н	OCHF2
Me	Me	H	H	0	н	н	CHF2	н	Cı
Me	Me	H	H	0	н	н	CF8	н	F
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	H	Cı
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₈	н	OMe
	•	•				•		•	•

Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	H	OEt
Me	Me	н	н	0	н	H	CF ₃	н	OCHF ₂
Me	Me	н	H	0	H	H	CF ₃	н	CN
Me	Me	н	н	0	н	H	CF ₃	H	Ме
Me	Me	н	н	0	H	H	Ħ	Ме	Cı
Me	Me	H	н	0	H	H	Ме	Me	Me
Me	Me	н	н	0	H	H	Me	Me	C1 .
Me	Me	H	H	0	H	H	C1	Ме	Ме
Me	Me	н	H	0	H	H	Et	Ме	C1
Me	Me	H	H	0	н	H.	Cı	Me	Et
Me	Me	H	H	0	H	H	Pr-i	Me	C1
Me	Me	н	H	0	H	H	CI	Ме	Pr-i
Me	Me	H	н	0	н	H	Bu-t	Me	C1
Me	Me	H	н	0	H	H	Cı	Me	Bu-t
Ме	Me	H	н	0	H	H	Cı	Me	Cı
Ме	Me	Η	H	0	н	H	CHF2	Me .	CI
Ме	Me	H	H	0	H	H	Cı	Me	CHF2
Me	Me	H	н	0	H	H	OCHF2	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Me	C1
Me	Me	H	H	0	H	H	CI	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	н	OCHF ₂	Me	OCHF ₂
Me		H	H	0	H	H	CF ₈	Me	H
Me		H	H	0	H	H	CF ₈	Me	C1
Me		H	H	0	H	H	CI	Me	CF ₃
Me		H	H	0	H	H	CF ₃	Me	F
Me		H	H	0	H		F	Me	CF ₈
Me		H	H	0	H	H	CF ₈	Me	OH
Me		H	H	0	H	H	OH	Me	CF ₈
Me		H	H	0	H	H	CF ₈	Me	OMe
Me		H	H	0	H	H	OMe	Me	CF ₈
Ме		н	H	0	H	H	CF ₃	Me	OEt
Me		H	H	0	H	H	OEt	Me	CF ₈
Ме		H	H	0	H	H	CF ₈	Me	OPr-i
Me		H	H	0	H	H	CF ₈	Me	OPr
Me	ľ	H	H	0	H	H	CF ₈	Me	OBu-t
Me		H	н	0	H	H	CF ₃	Me	OBu-s
Me	i .	H	H	0	H	H	CF ₈	Me	OBu-i
Ме	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	Ме	OBu

Me	Me	н	н	0	н	Н	CF ₃	Ме	O(2-Pen)
	Me	H	н	0	н	н	CF ₃	Me	O(3-Pen)
	Me	н	н	0	H	н	CF ₃	Me	OPen-n
- 1	Me	н	н	0	H	H	CF ₃	Me	O(2·Hex)
- 1	Me	H	H	0	н	н	CF ₃	Me	O(3-Hex)
	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	Me	OHex-n
1	Me	H	н	0	H	Н	CF ₈	Me	OPen-c
1	Me	H	H	.0	H	H	CF ₃	Me	OHex-c
1	Me	H	H	0	н	H	CF ₈	Me	OCH ₂ Pr-c
1	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Bu-c
1	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Pen-c
	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Hex-c
1	Me	H	н	0	н	H	CF ₃	Me	OCH2CH=CH2
1	Me	H	н	0	н	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C*CH
1	Me	Н	н	0	н	H	CF ₃	Me	OCHF ₂
1	Me	H	н	0	н	н	OCHF2	Me	CF ₃
1	Me	н	H	0	н	H	CF ₈	Me	OCH2CHF2
1	Me	н	Ħ	0	н	H	OCH2CHF	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	н	н	CF ₃	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	н	н	0	н	н	OCH ₂ CF ₃	Me	CF ₈
Me	Me	H	н	0	H	н	CF ₈	Me	OCH₂CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH2C(=O)OEt
Me	Me	H	н	0	н	H	CF ₃	Ме	OCH(Me)C(=0)OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH2C(=O)NH2
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C(=O)NHMe
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	Ме	OCH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	Me	OPh
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₈	Me	O(2-C1)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Me	O(2-Br)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF3	Me	O(2-F)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(2-Me)Ph
Me	Me	H	н	0	H	H	CF3	Me	O(2-OMe)Ph
Me	Me	н	H	0	H	H	CF ₈	Me	O(2·NO ₂)Ph
Me	Me	н	н	0	н	H	CF3	Me	O(2-CN)Ph
Me	Me	H	н	0	H	Ħ	CF ₈	Me	O(2-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	Me	O(3-C1)Ph

Me Me H H 0 H H CF3 Me O(3-Br)Ph Me Me H H H H H H CF3 Me O(3-F)Ph Me Me H H H H CF3 Me O(3-Me)Ph Me Me H H H CF3 Me O(3-NO2)Ph Me Me H H H H CF3 Me O(3-CN)Ph Me Me H H H H CF3 Me O(3-C(=O)OMe)Ph	
Me Me H H 0 H H CF3 Me O(3-Me)Ph Me Me H H 0 H H CF3 Me O(3-OMe)Ph Me Me H H 0 H H CF3 Me O(3-NO2)Ph Me Me H H H H CF3 Me O(3-CN)Ph Me Me H H CF3 Me O(3-C(=O)OMe)Ph	
Me Me H H 0 H H CF3 Me O(3-OMe)Ph Me Me H H 0 H H CF3 Me O(3-NO2)Ph Me Me H H H H CF3 Me O(3-CN)Ph Me Me H H CF3 Me O(3-C(=O)OMe)Ph	
Me Me H H 0 H H CF3 Me O(3-NO2)Ph Me Me H H 0 H H CF3 Me O(3-CN)Ph Me Me H H CF3 Me O(3-C(=O)OMe)Ph	
Me Me H H 0 H H CF3 Me O(3-CN)Ph Me Me H H CF3 Me O(3-C(=O)OMe)Ph	
Me Me H H O H CF3 Me O(3-C(=O)OMe)Ph	
Me Me H H O H H CF ₈ Me O(4-Cl)Ph	
Me Me H H O H H CF3 Me O(4-Br)Ph	
Me Me H H O H H CF3 Me O(4-F)Ph	
Me Me H H O H H CF3 Me O(4-Me)Ph	
Me Me H H O H H CF3 Me O(4-OMe)Ph	
Me Me H H 0 H H CF ₈ Me O(4-NO ₂)Ph	
Me Me H H O H H CFs Me O(4-CN)Ph	
Me Me H H O H H CF3 Me O(4-C(=O)OMe)Ph	
Me Me H H O H H CF ₃ Me OC(=O)Me	
Me Me H H O H H CF3 Me OC(=O)Et	
Me Me H H O H H CF3 Me OC(=O)CH ₂ Ph	
Me Me H H O H H CF3 Me OC(=O)CF3	
Me Me H H 0 H CF3 Me OC(=O)Ph	
Me Me H H O H H CF3 Me OSO2Me	
Me Me H H O H H CF3 Me OSO ₂ Et	
Me Me H H O H H CF3 Me OSO ₂ CH ₂ Ph	
Me Me H H O H H CF3 Me OSO2CF3	
Me Me H H O H H CF3 Me OSO2Ph	
Me Me H H O H H CF3 Me SMe	
Me Me H H O H H CF3 Me SO ₂ Me	
Me Me H H O H H CF3 Me SEt	
$M_{\rm e}$ $M_{\rm e}$ H H O H H CF_3 $M_{\rm e}$ SO_2Et	
Me Me H H O H H CF3 Me SPr	
Me Me H H O H H CF3 Me SO2Pr	
Me Me H H O H H CFs Me SPr-i	
Me Me H H O H H CF3 Me SO ₂ Pr-i	ĺ
Me Me H H O H H CF3 Me SBu-t	
Me Me H H O H H CF3 Me SO ₂ Bu-t	
Me Me H H O H H CF3 Me SCHF2	
Me Me H H O H H CF3 Me SO2CHF2	
Me Me H H O H H CF3 Me SCF3	

		,							
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	Ме	SPh
Me	Me	H	н	0	н	H	CF ₃	Me	SO_2Ph
Me	Me	H	Н	0	H	H	CF ₃	Ме	SCH ₂ Ph
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	Ме	SO ₂ CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=0)OEt
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ме	SCH(Me)C(=O)OEt
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH(Me)C(=0)OEt
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=0)NH ₂
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₈	Ме	SO ₂ CH ₂ C(=O)NH ₂
Me	Me	H	H	0	н	H	CF3	Me	SCH ₂ C(=0)NHMe
Me	Me	H	н	0	н	H	CF ₃	Ме	SO ₂ CH ₂ C(=O)NHMe
Me	Ме	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF3	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	Me	NH ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF₃	Me	NHMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Me	N(Me) ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Me	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	N(Me)C(=O)Me
Ме	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	NHSO2Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF _a	Me	N(Me)SO₂Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF₃	Me	NHSO2CHF2
Me	Me	H	Н	0	H	H	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	NHSO2CF3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	NHPh
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Me	N(Me)Ph
Ме		H	H	0	H	H	CF ₃	Ме	CN
Ме	Me	H	H	0	H	H	CN	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	C(=O)OCH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ме	C(=0)OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ме	C(=O)NH2
Me	Ме	H	н	0	н	н	CF ₃	Me	C(=O)NHMe
Me	Me	H	н	0	H	н	CF ₃	Me	C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	0	н	н	CF ₈	Me	C(=O)Me
Ме	Me	н	н	0	H	H	CF ₃	Me	C(=O)CF ₃

Ме	Ме	H	H	0	н	н	CF ₃	Me	C(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	н	н	CF ₃	Me	C(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	н	H	CF3	Ме	Me
Ме	Me	H	H	0	н	H	Me	Me .	CF ₃
Me	Me	H	H	0	н	н	CF ₃	Ме	Et
Me	Me.	H	н	0	н	Ħ	CF ₃	Ме	Pri
Ме	Me	H	н	0	н	H	CF ₈	Ме	Pr .
Me	Me	H	н	0	н	H	CF3	Me	CH ₂ OMe
Me	Me	н	н	0	H	H	CF ₃	Ме	CF ₃
Me	Me	H	н	0	н	H	CF ₃	Me	CHF ₂
Me	Me	H	н	0	н	H	CF ₃	Me	Ph
Me	Me	н	H	0	н	H	CF2CF3	Me	C1
Me	Ме	H	н	0	н	H	Ph	Ме	Me
Me	Me	н	н	0	н	H	Ph	Me	CI
Me	Me	н	н	0	н	н	Ph	Me	OEt
Me	Me	н	н	0	н	Ħ	Ph	Me	CF ₃
Me	Me	н	H	0	H	H	Ph	Me	Ph .
Me	Me	н	н	0	H	н	Cı	Et	Cl
Me	Me	H	H	0	н	н	OCHF2	Et	CI
Me	Me	H	н	0	н	H	Cl	Et	OCHF2
Me	Mе	H	H	0	H	H	OCHF2	Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Et	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Et	CI
Ме	Me	H	H	0	H	H	C1	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	н	CF3	Et	ОМе
Me	Me	н	H	0	H	H	ОМе	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	н	н	CF ₈	Et	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Et	CF ₈
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₂	Et	OCHF2
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF2	Et	CF ₈
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Et	CN
Me	Me	H	H	0	н	H	CN	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	н	н	CF ₃	Et	Me
Me	Me	H	H	0	н	H	Me	Et	CF ₈
Me	Me	H	H	0	H	н	C1	Pri	CI
Me	Me	H	н	0	H	н	OCHF2	Pr-i	CI
Me	Me	H	H	0	н	H	Cı	Pri	OCHF2

Me	Me	H	H	0	н	н	OCHF2	Pr-i	OCHF2
Me	Me	H	н	0	н	н	CF3	Pr-i	F
Me	Me	H	H	0	н	н	F	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	н	н	CF ₃	Pr-i	CI
Me	Me	н	H	0	н	н	Cl	Pri	CF ₃
Me	Мe	H	H	0	н	н	CF ₃	Pr-i	ОМе
Me	Me	H	H	0	н	H	OMe	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	н	н	CF ₃	Pr-i	OEt
Me	Me	H	H	0	н	н	OEt	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	Pr-i	OCHF2
Me	Me	н	Ħ	0	H	H	OCHF2	Pr-i	CF ₃
Me	Me	н	H	0	H	H	CF ₃	Pr-i	CN
Me	Me	H	H	0	н	H	CN	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr-i	Me .
Me	Me	H	H	0	Н	H	Me	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Cı	Pr .	CI
Me	Me	H	н	0	H	H	OCHF2	Pr	CI
Me	Me	H	H	0	H	H	C1	Pr	OCHF2
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF2	Pr	OCHF2
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr	F
1	Me	H	H	0	H	H	F	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr	CI
1	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pr	CF ₈
	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr	OMe
1	Me	H	H	0	H	H	ОМе	Pr	CF ₃
1	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr	OEt
1	Me	H	H	0	H	H	OEt	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr	OCHF2
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF2	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr .	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Мe	Pr	CF₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CI	Bu-t	C1
Me	Me	H	H	0	н	H	OCHF2	Bu-t	Cl
Me	Me	H	н	0	H	H	OCHF2	Bu-t	OCHF2
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Bu-t	H
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	Bu-t	F

Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₈	Bu-t	Cı
Me	Me	н	H	0	H	H	Cl .	Bu-t	CF ₃
Ме	Me	H	H	0	н	H	CF3	Bu-t	OMe
Me	Me	H	H	0	н	H	OMe	Bu-t	CF ₃
Me	Me	н	H	0	Ħ	H	CF ₈	Bu·t	OEt
Ме	Me	H	H	0	н	H	OEt	Bu·t	CF3
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	Bu-t	OCHF
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	Bu-t	CN
Ме	Me	н	H	0	H	H	CF ₃	Bu-t	Me
Me	Me	н	H	0	H	H	Me	Bu•t	CF ₃
Ме	Me	н	H	0	H	H	CF ₈	Bu-s	CI
Ме	Me	н	н	0	H	H	Cı	Bu·s	CF3
Me	Me	н	H	0	H	Ħ	CF ₃	Bu-i	Cl
Ме	Me	н	н	0	H	H	Cı	Bu-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	н	н	CF ₈	Bu	C1
Me	Me	н	H	0	H	H	Cı	Bu	CF3
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	1-Methylbutyl	Cı
Me	Me	H	н	0	H	н	Cı	1-Methylbutyl	CF ₃
Ме	Ме	H	н	0	H	H	CF ₈	1-Ethylpropyl	Cı
Me	Me	н	H	0	H	H	Cl	1-Ethylpropyl	CF ₈
Me	Me	н	H	0	н	н	CF ₈	1-Pentyl	CI
Me	Me	н	н	0	H	H	CI	1-Pentyl	CF ₈
Me	Me	н	н	0	H	н	CF ₃	1-Methylpentyl	CI
Ме	Me	н	H	0	н	н	C1	1-Methylpentyl	CF3
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₈	2-Ethylbutyl	CI
Me	Me	H	H	0	H	н	CI	2-Ethylbutyl	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	3,3-Dimethylbutyl	CI
Me	Me	H	H	0	н	н	Cı	3,3-Dimethylbutyl	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	1-Hexyl	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Ci	1-Hexyl	CF ₈
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₈	1-Heptyl	CI
Me	Me	н	н	0	H	H	CI	1-Heptyl	CF ₈
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	1-Octyl	CI
Me	Me	н	н	0	н	н	Cı	1-Octyl	CF ₈
Me	Me	H	н	0	H	н	CF ₈	CH₂Ph	Cl
Me	Me	н	н	0	н	н	Cı	CH ₂ Ph	CF ₈
Me	Me	н	н	0	н	н	CF ₈	Prc	Cl
Me	Me	н	н	0	н	н	CF ₈	Pen·c	Cl
ı	•	1		•	1	ı	1	1	•

Me	Me	н	н	0	н	н	C1	Pen-c	CF ₈
Me	Me	Н	н	0	H	н	CF ₃	Нех-с	Cı
Me	Me	H	H	0	н	H	C1	Нех-с	CF ₃
Me	Me	н	н	0	H	H	C1	CH ₂ Pr-c	CI
Me	Me	н	н	0	H	н	OCHF2	CH ₂ Pr-c	Cı
Me	Me	H	н	0	H	H	Cl	CH₂Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF2	CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	F
Me	Me	H	н	0	H	H	F	CH₂Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	CI
Me	Me	H	н	0	H	H	C1	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	CN
Me	Me	Н	н	0	H	Н	CF ₃	CH ₂ Pr-c	он
Me	Me	н	H	0	H	н	CF ₃	CH ₂ Prc	ОМе
Me	Ме	H	H	0	н	н	OMe	CH ₂ Pr-c	CF3
Me	Me	H	Ħ	0	н	H	CF3	CH₂Pr-c	OEt
Me	Me	н	н	0	н	н	OEt	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH₂Pr-c	OPr-i
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	CH₂Pr-c	OPr
Me	Me	H	H	0	H	н	CF3	CH₂Pr-c	OBu-t
Me	Me	H	H	0	н	н	CF3	CH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	CH₂Pr-c	OCH ₂ Bu-c
Me	Me	н	H	0	H	H	CF3	CH ₂ Pr-c	OPen-c
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₈	CH₂Pr-c	OCHF2
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF2	CH₂Pr-c	CF₃
Ме	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	CN
Me	Me	H	н	0	н	H	CN	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	CH ₂ Pr-c	Me
Me	Me	H	н	0	н	H	Me	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Ме	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	1-cyclopropylethyl	Cı
Me	Me	H	н	0	н	H	Cl	1-cyclopropylethyl	CF ₃
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	CH ₂ (2·Methyl·cyclopropyl	C1
Me	Me	н	н	0	н	H	Cl	CH ₂ (2-Methyl-cyclopropyl	CF ₈
Me	Me	H	н	0	н	H	CF3	CH ₂ (2,2-Dimethyl-cyclopropyl)	Cl
Me	Me	н	н	0	н	H	Cl	CH ₂ (2,2-Dimethyl-cyclopr opyl)	CF ₈
Me	Me	н	н	0	н	H	CF ₃	CH2(2-Chloro-cyclopropyl)	Cı
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH2(2-Chloro-cyclopropyl)	CF ₃

Me Me H H O H H CF3 CH2(2,2-Dichloro-cyclopro Cl Me Me H H O H H Cl CH2(2,2-Dichloro-cyclopro pyl) Me Me H H O H H CF3 CH2(2,2-Dichloro-cyclopro pyl) CH2(2-Fluoro-cyclopropyl) Cl	
Me Me H H O H H Cl CH2(2,2-Dichloro-cyclopro pyl)	
large large large large large large and large and large larg	
Me Me H H O H H Cl CH2(2-Fluoro-cyclopropyl) CF3	
Me Me H H O H H CF3 CH2(2,2-Difluoro-cyclopro Cl	
Me Me H H O H H Cl CH2(2,2-Difluoro-cyclopro CF3	
Me Me H H O H H CF3 CH2Bu-c Cl	
Me Me H H O H H Cl CH2Bu-c CF3	
Me Me H H O H H CF3 CH2Pen-c Cl	
Me Me H H O H H Cl CH2Pen-c CF3	
Me Me H H O H H CF3 CH2Hex-c Cl	•
Me Me H H O H H Cl CH2Hex-c CF3	
Me Me H H O H H CF3 CH2CH2Pr-c Cl	
Me Me H H O H H Cl CH2CH2Pr-c CF3	
Me Me H H O H H CF3 CH2CH=CH2 CI	
Me Me H H O H H Cl CH2CH=CH2 CF3	
Me Me H H O H H CF3 CH2CH=CHCl Cl	
Me Me H H O H H Cl CH2CH=CHCl CF3	
$M_{e} M_{e} H H O H H CI CH_{2}C \equiv CH CI$	
Me Me H H O H H OCHF2 CH2C≡CH Cl	٠
Me Me H H O H H Cl CH ₂ C≡CH OCHF ₂	
Me Me H H O H H OCHF2 CH2C≡CH OCHF2	
$M_{\rm e}$ $M_{\rm e}$ H H 0 H H CF_8 $CH_2C \equiv CH$	
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	
$M_{0} M_{0} H H O H H CF_{3} CH_{2}C \equiv CH$	
Me Me H H 0 H H Cl CH2C≡CH CF3	•
Me Me H H O H H CF3 CH2C≡CH OMe	•
Me Me H H O H H OMe CH2C≡CH CF3	
Me Me H H O H H CF3 CH2C≡CH OEt	
Me Me H H O H H OEt CH2C≡CH CF3	
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	
Me Me H H O H H OCHF2 CH2C≡CH CF3	
Me Me H H O H H CF3 CH2C≡CH CN	
Me Me H H O H H CN CH₂C≡CH CF₃	
Me Me H H O H H CF ₈ CH ₂ C≡CH Me	
Me Me H H O H H Me CH2C≡CH CF3	
$ M_{e} M_{e} H H 0 H H CF_{3} CH_{2}C \equiv CH CI $	

			_						
Me	Me	H	H	0	H	H	Cı	CH₂C≡CH	CF ₈
Me	Me	н	н	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CMe	CI
Me	Me	H	н	0	H	H	Cı	CH ₂ C≡CMe	CF ₃
Me	Me	H	н	0	H	H	Cı	CHF ₂	CI
Me	Me	H	н	0	Н	H	OCHF2	CHF ₂	Cı
Me	Me	H	н	0	H	H	Cl	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF2	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CHF ₂	CI .
Me	Me	H	H	0	н	H	Cl	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CHF ₂	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	CHF ₂	CF ₈
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CHF ₂	ОМе
Me	Me	H	н	0	н	H	ОМе	CHF ₂	CF ₃
Ме	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	CHF ₂	OEt
Me	Me	Ħ	H	0	н	н	OEt	CHF ₂	CF ₃
Me	Me .	H	H	0	н	H	CF ₂	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF2	CHF ₂	CF3
Me	Mę	H	H	0	н	H	CF ₃	CHF ₂	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	CHF ₂	CF ₈
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	CHF ₂	CI
Me	Me	H	H	0	H	H	C1	CHF ₂	Ме
Me	Me	H	H	0	H	H	Et	CHF ₂	C1
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CHF ₂	Et
Me	Me	н	H	0	н	H	CF ₈	CH2CHF2	[CI
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH2CHF2	CF ₃
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	C1
Me	Ме	H	H	0	H	H	Cl	CH2CF3	CF ₈
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ OH	CI
Me	Me	H	H	0	H	H	C1	CH ₂ OH	CF ₃
Me	Me	H	н	0	H	н	Cl	CH ₂ OMe	CI
Ме	Me	H	н	0	н	H	OCHF ₂	CH₂OMe	cı l
Ме	Me	H	H	0	н	н	Cl	CH ₂ OMe	OCHF2
Me	Me	H	н	0	н	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	OCHF2
Ме	Me	н	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	F
Ме	Me	H	н	0	н	H	F	СН2ОМе	CF ₃
Me	Me	н	н	0	н	н	CF ₃	СН2ОМе	Cl
			,	•		1			: !

_								•	1
Me 1	Мe	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ OMe	CF ₈
Me I	Мe	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	OMe
Me	Мe	H	H	0	H	н	OMe	CH ₂ OMe	CF ₃
Me]	Me	н	H	0	н	H	CF ₃	CH ₂ OMe	OEt
Me	Мe	H	H	0	H	H	OEt	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	н	0	н	H	CF ₈	CH ₂ OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF2	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	н	н	0	н	H	CF ₈	CH ₂ OMe	CN
Me	Мe	н	H	0	н	H	CN	CH₂OMe	CF ₈
Me	Me	H	Ħ	0	H	H	CF3	CH ₂ OMe	Me
Me	Me .	н	H	0	H	H	Me	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me ·	н	H	0	H	H	CF ₈	CH₂OEt	Cı
Me	Me	H	Ħ	0	н	H	CI	CH₂OEt	CF ₈
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₈	CH ₂ CH ₂ OH	Cı
Ме	Me	н	H	o	н	H	Cı	CH₂CH₂OH	CF ₈
Me	Me	н	H	0	н	H	CF ₈	CH ₂ CH ₂ OMe	Cl
Ме	Me	н	H	0	H	н	Cı	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	н	H	0	H	н	CF ₈	CH ₂ CH ₂ OEt	Cl
Me	Me	н	н	0	H	н	CI	CH ₂ CH ₂ OEt	CF ₈
Me	Me	н	н	0	H	н	CF ₈	CH₂NHMe	Cı
Me	Me	н	н	0	H	н	CI	CH₂NHMe	CF ₈
Me	Me	н	H	0	н	н	CF3	CH2N(Me)2	Cl
Me	Me	H	H	0	н	н	Cı	CH2N(Me)2	CF ₈
Me	Me	н	H	0	н	н	CF ₃	CH ₂ N(Me)C(=O)Me	C1
Me	Me	H	н	0	H	H	Cı	CH₂N(Me)C(=O)Me	CF ₈
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₈	CH2N(Me)C(=O)CF3	Cı
Me	Me	н	·Η	0	H	H	CI	CH2N(Me)C(=O)CF8	CF ₈
Me	Me	н	н	0	H	н	CF ₃	CH2N(Me)SO2Me	Cı
Me	Me	H	н	0	H	H	Cı	CH₂N(Me)SO₂Me	CF3
Me	Me	H	H	0	н	н	CF ₃	CH₂N(Me)SO₂CHF2	Cı
Me	Me	H	H	0	н	H	Cı	CH2N(Me)SO2CHF2	CF ₈
Me	Me	н	H	0	H	H	CF ₈	CH2N(Me)SO2CF8	Cl
Me	Me	H	н	o	H	H	Cl	CH2N(Me)SO2CF3	CF ₈
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	CH₂SMe	Cı
1	Me	H	1	0	H	H	CI	CH ₂ SMe	CF ₈
1	Me	Н		0	H	H	CF ₈	CH ₂ SO ₂ Me	C1
l.	Me	H	1	0	H	H	Cı	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃
1	Me	H			1	н	CF ₈	CH ₂ CH ₂ SMe	CI
1	1	1-1	1	1	1	1	i i	I	•

	•								•
Me	Ме	H	н	0	H	H	CI	CH ₂ CH ₂ SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	Q	Н	H	CF ₃	CH2CH2SO2Me	Cl
Me	Me	H	H	0	н	H	C1	CH2CH2SO2Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CN	C1
Me	Me	H	H	0	H	H	Cı	CH₂CN	CF ₃
Me	Ме	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)OMe	C1
Me	Me	H	H	0	H	Н	Cl	CH ₂ C(=O)OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	CH ₂ C(=O)OEt	CI
Me	Me	H	H	0	н	H	CI	CH ₂ C(=O)OEt	CF ₈
Me	Ме	H	H	0	H	н	CF ₃	CH(Me)C(=O)OMe	CI .
Me	Me	H	H	0	H	H	C1	CH(Me)C(=O)OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	C(Me) ₂ C(=O)OMe	CI
Me	Me	H	H	0	H	н	CI	C(Me) ₂ C(=O)OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₈	CH ₂ C(=O)NH ₂	CI
Me	Me	H	H	0	H	H	CI	CH ₂ C(=O)NH ₂	CF ₈
Me	Me	н	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)NHMe	Cı
Me	Me	H	H	0	H	H	C1	CH ₂ C(=O)NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	CI
	Me	H	H	0	H	H	C1	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	CF ₃
1 1	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH₂C(=O)Me	Cı
Me	l :	H	н	0	H	H	CI	CH ₂ C(=O)Me	CF ₃
Me		H	н	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=NOMe)Me	CI
Me		H	н	0	H	H	CI	CH2C(=NOMe)Me	CF ₃
Me		H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)CF ₃	CI
Me	! !	H	H	0	H	H	CI	CH ₂ C(=O)CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(=O)Me	Cl
Me		H	H	0	H	H	CI	CH ₂ CH ₂ C(=O)Me	CF ₃
Me	1	H	H	0	H		Me	Ph	Me
Ме		H	H	0	H		Ме	Ph	CI
Ме		H	H	0	H	H	Et	Ph	C1
Me		H	H	0	H	H.	Pr	Ph	[C1
Me		H	H	0	H	H	Pr-i	Ph	C1
Ме		H	Н	0	H	H	Bu-t	Ph	Cı
Ме	Me	H	H	0	H	H	CH ₂ OMe	Ph	CI
Ме	Me	H	H	0	н	H	Cl	Ph	C1
Ме	Me	H	H	0	H	H	OCHF2	Ph	C1
Ме	Me	H	н	0	H	H	OCHF2	Ph	OCHF2
Me	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	Ph	Cl

Ме	Me	н	н	0	н	н	CF ₃	Ph	н
Ме	Me	H	н	0	н	H	CF ₃	Ph	Ме
Me	Me	H	н	0	H	H	Me	Ph	CF ₃
Me	Me	H	н	0	н	н	CF ₃	Ph	Et
Me	Ме	н	н	0	н	H	CF ₃	Ph	Pr-i
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	Рĥ	CHF ₂
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	Ph	CF ₃
Ме	Me ·	н	н	0	н	H	CF ₈	Ph	F
Ме	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	Ph	C1
Me	Me	Ħ	H	0	н	н	Cl	Ph ,	CF ₃
Me	Me	н	H	0	н	H	CF ₃	Ph .	он
Ме	Me	H	H	0	H	H	он	Ph	CF ₃
Me	Me	н	H	0	н	H	CF ₃	Ph	OMe
Me	Me	н	H	0	н	H	ОМе	Ph	CF ₃
Me	Me	н	H	o	н	H	CF ₃	Ph	OEt
Me	Me	H	H	0	н	H	OEt	Ph	CF ₃
Me	Me	н	H	0	н	H	CF ₃	Ph	OPr-i
Me	Me	н	н	0	H	H	CF ₃	Ph	OPr
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	Ph	OBu-t
Me	Me	н	н	0	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₂	Ph	OCH ₂ CH=CH ₂
1	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ C≡CH
1	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OCHF ₂
1	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Ph	CF ₈
1	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ CHF ₂
1	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Ph	OCH ₂ CF ₈
1	Me	H	H	O	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ C(=O)OMe
1	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Ph	OCH(Me)C(=O)OMe
1	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Ph	OC(Me) ₂ C(=0)OMe
1	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OC(=0)Me
	Me	H	H	O	H	H	CF ₃	Ph	OC(=0)Et
1.	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Ph	OC(=0)CH ₂ Ph
i	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Ph	OC(=O)CF ₈
1	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Ph	OC(=O)Ph
1	Me	H	H	0	H	н	CF ₈	Ph	OSO ₂ Me
1	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OSO₂Et
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₈	Ph	OSO ₂ CH ₂ Ph
Me	Me	H	Н	0	H	Н	CF ₈	Ph	OSO ₂ CF ₈

WO 02/062770

	Ме	Me	н	H	0	н	н	CF ₈	Ph	OSO ₂ Ph	
	Ме	Me	н	H	0	H	H	CF3	Ph	SMe	l
	Ме	Ме	н	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SO₂Me	
	Ме	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	Ph	SEt	
	Ме	Me	н	н	0	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Et	١
	Ме	Me	н	Ħ	0	H	H	CF3	Ph	SPr-i	
	Ме	Me	H	н	0	H	H	CF3	Ph	SO₂Pr-i	l
	Me	Me	н	H	0	н	H	CF3	Ph	SPr	ŀ
	Ме	Ме	н	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Pr	l
	Me	Me	н	H	0	H	H	CF3	РЬ	SBu-t	
	Ме	Me	н	H	0	H	H	CF3	Ph	SO ₂ Bu-t	
	Ме	Me	н	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SCHF₂	
	Ме	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ CHF ₂	
	Ме	Ме	н	H	0	H	H	CF3	Ph	NH ₂	
	Me	Ме	н	H	0	H	H	CF3	Ph	NHMe	l
	Ме	Me	H	H	0	н	н	CF ₃	Ph	N(Me) ₂	ĺ
	Ме	Me	н	H	0	H	н	CF3	Ph	NHC(=0)Me	
	Ме	Me	н	H	0	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)C(=0)Me	
	Ме	Ме	H	H	0	н	H	CF ₃	Ph	NHSO2Me	
	Ме	Me	н	H	0	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)SO ₂ Me	
	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	NHSO ₂ CF ₃	
	Ме	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)SO ₂ CF ₃	ı
1	Ме	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Ph	NHPh	
	Ме	Ме	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)Ph	
	Ме	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	CN	
	Me	Ме	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)Me	
	Ме	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Ph	C(=O)OMe	
	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)NH2	
	Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	Ph	C(=O)NHMe	
	Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	Ph	C(=O)N(Me) ₂	
	Ме	Me	H	H	0	н	н	CF ₃	Ph	Imidazol-1-yl	
	Me	Ме	H	H	0	H	Ħ	CF ₃	Ph	Pyrazol·1-yl	
	Ме	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	1,2,4-Triazol-1-yl	
	Me	Ме	н	Ĥ	0	H	н	CF₃	Ph	1,2,4-Triazol-4-yl	
	Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	Ph	Tetrazol-1-yl	
	Me	Me	H	н	0	н	н	CF ₃	Ph.	Tetrazol·5-yl	
i	Ме	Me	н	H	0	н	н	CF ₈	Ph	(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)oxy	

Me	Me	н	н	0	н	н	CF ₈	Ph	(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl))sulfonyl
Me	Me	н	H	0	H	н	CF ₂ CF ₃	Ph	CI
Me	Me	H	н	0	н	H	CF ₃	(2-Cl)Ph	C1
Me	Ме	н	н	0	н	н	CF ₃	(2-F)Ph	C1
Me	Ме	H	н	0	н	н	CF3	(2-OMe)Ph	CI
Me	Ме	н	н	0	H	н	CF ₃	(2-Me)Ph	Cı
Me	Me	н	н	0	н	H	CF ₃	(2-NO ₂)Ph	Cı
Me	Ме	H	H	0	H	Ħ	CF ₃	(2-CN)Ph	CI
Me	Ме	H	H	0	н	н	CF ₃	(2-C(=0)Me)Ph	Cı
Me	Ме	H	н	0	н	H	CF ₃	(2-C(=O)OMe)Ph	Cı
Me	Me	н	H	0	н	H	CF3	(2-C(=0)OEt)Ph	Cı
Me	Ме	н	н	0	H	H	CF ₃	(2-C(=0)OPr-i)Ph	Cı
Me	Me	H	H	0	н	H	CF3	(2-C(=0)NH ₂)Ph	Cı
Me	Me	н	H	0	н	H	CF3	(2-C(=0)NHMe)Ph	Cı
Me	Me	H	н	0	н	H	CF3	(2-C(=0)NMe ₂)Ph	Cı
Me	Me	H	H	0	H	H	CF3	(3-C1)Ph	Cı
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	(3·F)Ph	CI
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₈	(3-OMe)Ph	CI
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-Me)Ph	CI
Me	Me	н	н	0	H	H	CF ₈	(3-NO₂)Ph	Cı
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₃	(3-CN)Ph	Cı
Me	Me	H	н	0	Ħ	H	CF ₃	(3-C(=O)Me)Ph	C1
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3·C(=O)OMe)Ph	CI
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-C(=0)OEt)Ph	Cı
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-C(=O)OPr-i)Ph	C1
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-C(=O)NH ₂)Ph	CI
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-C(=O)NHMe)Ph	CI
- 1	Me	H	ł	0	H	H	CF ₈	(3-C(=0)NMe ₂)Ph	C1
	Me	H	1	0	H	H	CF ₈	(4·Cl)Ph	C1
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4·F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-OMe)Ph	C1
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	(4·Me)Ph	CI
	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	(4·NO ₂)Ph	C1
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4·CN)Ph	C1
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-C(=O)Me)Ph	C1
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-C(=O)OMe)Ph	CI
Me	Me	H	H	0	H	Н	CF ₃	(4-C(=O)OEt)Ph	cı

WO 02/062770 PCT/JP02/01015

Me	Me	н	H	0	н	н	CF3	(4-C(=O)OPr-i)Ph	4-C(=O)OPr-i)Ph Cl					
Me	Me	H	H	0	H	H	CF3	(4-C(=0)NH2)Ph	C1					
Me	Me	н	H	0	H	H	CF ₃	(4-C(=0)NHMe)Ph	C1					
Me	Me	H	H	0	н	H	CF3	(4-C(=O)NMe ₂)Ph	CI					
Me	Me	H	н	0	H	H	CF3	Pyrmidin-2-yl	C1					
Me	Me	H	H	0	H	H	CF3	4,6-Dimethoxypyrmidin-2-yl	Cl					
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Thiophen-2-yl	C1					
Me	Me	H	H	0	H	н	CF ₃	Furan-2-yl	C1					
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	SO ₂ Me	C1					
Me	Ме	H	H	0	H	Ħ	CF₃	SO₂Et	CI					
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	SO₂P r- i	C1					
Me	Me	H	H	0	H	H	CF3	SO ₂ CH ₂ Ph	C1					
Me	Me	H	H	0	H	H	CF3	SO ₂ CHF ₂	CI					
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	SO ₂ CF ₃	CI					
Me	Me	H	H	0	н	H	CF3	SO ₂ Ph	CI					
Me	Me	н	H	0	н	н	CF ₃	C(=O)Me	C1					
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)Et	CI					
Me	Me	H	H	0	н	н	CF ₈	C(=0)Pr-i	C1					
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	C(=0)Bu-t	CI					
Me	Me	H	H	0	н	н	CFs	C(=O)Ph	C1					
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	C(=O)CH2Ph	C1					
Me	Me	H	H	0	Н	H	CF ₃	C(=O)CH ₂ Cl	C1					
Me	Me	H	H	0	H	H	CF3	C(=O)CHCl2	C1					
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	C(=O)CF ₃	C1					
Me	Me	H	н	0	н	H	CF ₃	C(=O)OMe	[C1					
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	C(=O)OPh	C1					
Ме	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)OCH ₂ Ph	C1					
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)NHMe	C1					
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)N(Me)2	CI					
Me	Me	H	н	0	H	H	CF ₈	C(=O)NHPh .	C1					
Me	Me	н	н	0	н	н	CF3	NH2	CI					
Me	Me	H	H	0	H	н	CI	·(C	:H₂)₂O-					
Me	Me	H	н	0	H	H	C1	-(CH ₂) ₈ O-						
Me	Me	н	н	0	H	н	Cl	-(CH2)3S-						
Me	Me	H	н	0	H	н	Cl	-(CH ₂) ₈ SO ₂ -						
Me	Me	H	н	0	н	н	CF ₃	-(CH ₂) ₂ O-						
1	Me	н	н	0	H	н	CF ₈	-(c	H ₂) ₃ O-					
	Me	H	!	0	H	н	CF ₃	-(CH₂) ₈ S-						
1	1	1	,	1	1	1	1	/OI15/8D						

I	L_ I	I	1		I	1	an.	1	(OTT.) GO
Me		H	H	0	H		CF ₃		-(CH ₂) ₃ SO ₂ -
Me	Me	H	H	0	H		OMe		-(CH ₂) ₄ -
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂		-(CH ₂) ₄ -
H	н	Ħ	H	0	H	H	CF3	Me	CI
Me	н	Ħ	H	0	н	H	CF ₃	Me]cı
Me	н	Me	H	o	H	H	CF ₃	Me	C1
Me	Me	Me	H	o	н	H	CF3	Me	C 1
Me	Me	н	н	o	Ме	н	CF ₈	Me	CI
Me	Me	H	H	0	Et	H	CF3	Me	CI
Me	Me	н	H	o	Pr-i	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	Ħ	н	0	Me	Me	CF3	Me	Cı
Me	Et	н	H	0	н	H	CF ₃	Me	Cl
Et	Et	н	н	0	н	Н	CF ₃	Me	Cl
Me	Pr-i	н	H	0	н	H	CF3	Me	Cl
Me	Pr	H	н	0	H	н	CF ₈	Me	Cl
Me	Pr-c	н	н	0	H	н	CF3	Me	Cı
Me	CH ₂ Pr-c	н	н	o	н	н	CF ₃	Me	Cl
	(CH ₂) ₂ -	н	н	0	н	H	CF ₃	Me	cı .
.	(CH ₂) ₈ -	H	н	0	н	H	CF ₃	Me	Cl
.	(CH ₂) ₄ -	H	н	0	н	н	CF ₈	Me	Cl
.	(CH ₂) ₅ -	H	H	0	H	н	CF ₃	Me	CI ·
H	-(CH	5)3.	н	0	н	н	CF ₈	Me	C1
H	ŧ		н	0	H	н	CF ₈	Me	C1
H	1		H	0	H	н	CFs	Me	C1
H	1		H	0	H	H	CF ₈	Me .	Ci
Me	Et	H	Н	2	H	H	н	н	H
			ــــــــــــــــــــــــــــــــــــــ	—	٠	ь	<u> </u>		<u> </u>

表4

$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$												
	,	·		,				R ³²				
R1	R ²	R ³	R4	n	R ⁵	R ⁶	↓_	\mathbb{Z}^{3}	R ⁸¹	R ⁸²		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		Me	F		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		Me	C1		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		Me	OMe		
Me	Ме	H	H	2	H	H	0		Ме	OEt		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		Me	OPr-i		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		Me	OPh		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		Me	OCHF ₂		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		Me	Me		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		Me	CF ₃		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		Me	CN		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		OCHF ₂	F		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		OCHF ₂	Cl		
Ме	Me	H	H	2	H	H	0		OCHF ₂	Ме		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		OCHF ₂	CF ₃		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		OCHF ₂	CN		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		CF ₈	F		
Me	Me	H	Н	2	H	H	0		CF ₃	Cl		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		CF ₈	OMe		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		CF ₈	OEt		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		CF ₃	OPr-i		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		CF ₃	OPh		
Me	Me	H	Н	2	H	H	0		CF ₃	OCHF ₂		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		CF ₈	SMe		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		CF ₃	SOMe		
Me	Me	H	H	2	Н	H	0		CF3	SO ₂ Me		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		CF ₃	SEt		
Me	Me	H	Н	2	H	H	0	:	CF3	SOEt		
Me	Me	H	Н	2	H	H	0		CF ₈	SO ₂ Et		
Me	Me	H	H	2	H	H	0		CF₃	SPr-i		
Me	Me	H	Н	2	H	H	0		CFs	SOPr-i		
Me	Me	H	H	2	Н	H	0		CF ₃	SO ₂ Pr-i		
Me	Me	H	н	2	н	H	0		CF ₃	SPh		
Me	Ме	H	H	1 1		H	0		CF3	SOPh		

Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	SO ₂ Ph
Ме	Me	н	H	2	H	H	О	CF ₈	SCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	\mathbf{H}	0	CF ₃	SOCHF ₂
Me	Me	н	H	2	H	H	О	CF ₃	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	SCF ₈
Me	· Me	H	H	2	H	H	О	CF ₃	SOCF ₈
Me	Me	н	Н	2	H	H	О	CF ₃	SO ₂ CF ₃
Ме	Me	н	H	2	н	H	0	CF ₃	NH2
Me	Me	н	H	2	H	H	О	CF ₃	NHC(=O)Me
Me	Me	н	н	2	н	H	Ю	CF ₃	NHC(=O)Ph
Me	Me	н	H	2	H	H	0	CF ₃	NHC(=O)CH2Ph
Me	Me	H	н	2	H	H	0	CF ₃	NHC(=O)CF3
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	NHSO ₂ Me
Me	Ме	н	н	2	н	H	0	CF ₃	NHSO ₂ Ph
Me	Me	н	H	2	Н	Н	О	CF ₃	NHSO ₂ CHF ₂
Me	Me	н	Н	2	H	н	О	CF ₃	NHSO ₂ CF ₈
Me	Me	н	н	2	н	H	0	CF ₃	NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	О	CF ₃	NHPh
Me	Me	н	H	2	H	H	О	CF ₃	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₈	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	N(Me)C(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	О	CF ₃	N(Me)C(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	N(Me)SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	· H	H	0	CF ₃	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Н	2	H	H	0	CF ₃	N(Me) ₂
Me	Me	H	н	2	H	H	0	CF ₃	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	О	CF ₈	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	CN
Me	Me	H	н	2	H	H	О	Ph	Me
H	H	H	H	2	H	H	0	CF ₃	Me
Me	Н	H	H	2	H	H	0	CF ₃	Me
Me	H	Me	H	2	H	H	0	CF3	Me
Me	Me	Me	H	2	H	Н	0	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	Me	H	О	CF ₈	Me
Me	Me	H	H	2	Et	H	0	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	Pr-i	н	0	CF ₈	Me [.]
Me	Me	H	н	2	Me	Me	0	CF ₃	Me
Me	Et	H	Н	2	H	H	0	CF ₃	Me
Et	Et	H	H	2	H	н	0	CF ₃	Me
Me	Pr-i	H	н	2	H	H	0	CF ₃	Ме

Me	Pr	н	н	2	н	Н	lo	CF ₈	l e
Me	Pr-c	Н	Н	2	H	Н	О	1 1	le .
Me	CH ₂ Pr-c	Н	Н	2	H	H	Ю	CF ₃	
	CH ₂) ₂ -	н	H	2	H	H	0	CFs M	
1	CH ₂) ₃ -	H	Н	2	H	н	o	CF ₃	
1	-(CH ₂) ₄ -		Н	2	H	н	o	CF ₃	
	-(CH ₂) ₅ -		Н	2	H .	н	o	CF ₃	
H	-(CH ₂)	H 8-	Н	2	н	н	0	CF ₃	
H	-(CH ₂)		н	2	H	Н	0	CF ₃	
H	-(CH ₂)		H	2	H	Н	0	CF ₈	
H	-(CH ₂)		H	2	H	H	o	CF ₃	
Me	Me	H	H	2	Н	Н	s	Me F	
Me	Me	H	Н	2	H	н	s	Me C	
Me	Me	H	H	2	Н	н	s	1	Me
Me	Me	Н	н	2	H	н	s	1 1	Et .
Me	Me	Н	Н	2	H	н	s		Pr-i
Me	Me	н	H	2	н	Н	S		Ph
Me	Me	н	H	2	H	н	s	1 1	CHF ₂
Me	Me	н	Н	2	H	н	s	OCHF₂ F	
Me	Me	н	н	2	H	н	s	OCHF ₂ C	1
Me	Me	н	Н	2	H	н	s	OCHF ₂ M	[e
Me	Me	н	H	2	H	н	s	OCHF ₂ C	F ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	s	OCHF ₂ C	N
Me	Me	н	H	2	H	н	s	CF ₃ F	
Me	Me	Н	H	2	H	Н	s	CF ₈ C	l
Me	Me	H	H	2	H	H	s	CF ₃ O	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	s	CF ₃ O	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	s		Ph .
Me	Me	H	H	2	H	Н	s	1 1	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	s	1 1	Ме
Me	Me	H	H	2	H	H	S	1 1	ОМе
Ме	Me	H	H	2	H	H	s		O₂Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃ SI	
Me	Me	H	H	2	H	H	s		DEt
Me	Me	H	H	2	H	Н	S		O ₂ Et
Me	Me	H	H	2	H	Н	S	1 1	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	S		OPr-i
Me	Me	H	H	2	H	Н	S	1 1	O₂Pr-i
Ме	Me	H	H	2	H	Н	S	1 -	Ph .
Me	Me	H	H	2	H	H	S		OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	S		O ₂ Ph
Ме	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃ SC	CHF ₂

Me Me H H L H H S CF3 SO₂CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 SO₂CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 SO₂CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)Me Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)Me Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)Me Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CH2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CH2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CH2Ph Me Me	. :	i)	. 1	,		ı		•
Me Me H H 2 H H S CF3 SCCF3 Me Me H H 2 H H S CF3 SOCF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)Me Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)Me Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)Me Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CH2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CH2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CH2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CH2Ph Me Me	Me	Me	H	H	2	H	Н	s	CF ₃	SOCHF ₂
Me Me H H 2 H H S CF3 SOCF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CH3Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CH3Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CH3Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CH3Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CH3Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CH3Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHMc(=C)CH3Ph Me			H	H	i i		Į.			=
Me Me H H 2 H H S CFs SO2CFs Me Me H H 2 H H S CFs NHC(=O)Me Me Me H H 2 H H S CFs NHC(=O)Me Me Me H H 2 H H S CFs NHC(=O)Ph Me Me H H 2 H H S CFs NHC(=O)CH2Ph Me Me H H 2 H H S CFs NHC(=O)CH2Ph Me Me H H 2 H H S CFs NHC(=O)CH2Ph Me Me H H 2 H H S CFs NHSO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CFs NHSO2CHF2 Me Me			н	ŀ	2			1	3	
Me Me H H 2 H H S CF3 NHc(=0)Me Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=0)Me Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=0)CH2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=0)CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=0)CH2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CH3Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHHSO2CH3Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHMG(=0)CH3Ph Me Me	Me	Me	H	H	2	H	Н	- 1	CF ₃	SOCF ₈
Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=0)Me Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=0)CH2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=0)CH2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO ₂ CHe Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO ₂ CHe Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO ₂ CHe Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO ₂ CHe Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO ₂ CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO ₂ CF3 Me Me	Me		н		2		Н		CF ₃	SO ₂ CF ₃
Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=0)Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=0)CF3Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CHF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHMeO2C(=O)Me Me Me	Ме		H	H	2				CF ₃	
Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CH2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=O)CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2Me Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2Me Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHMSO2CF3 Me Me <t< td=""><td>Ме</td><td></td><td>H</td><td>H</td><td>2</td><td>H</td><td>ľ</td><td></td><td>CF₃</td><td>1</td></t<>	Ме		H	H	2	H	ľ		CF ₃	1
Me Me H H 2 H H S CF3 NHC(=0)CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2Me Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CH2 Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CH5 Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CH6 Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CH5 Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CH6 Me Me H H 2 H H S CF3 NIMeO2C(=O)CH6 Me Me <	Me	Me	Н	H	2		H		CF ₃	NHC(=O)Ph
Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2Me Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CHP2 Me Me H H 2 H H S CF3 NHMSO2CHP2 Me Me H H 2 H H S CF3 NHMSO2CHP2 Me Me H H 2 H H S CF3 NHMSO2CFB3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHMSO2CFB3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHMSO2CFB3 Me Me	Ме	Me	H	H	2	H	H		CF ₃	NHC(=O)CH ₂ Ph
Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 NHMSO2CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHMSO2CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHPh Me Me H H 2 H H S CF3 NHPh Me Me H H 2 H H S CF3 NHPh Me Me H H 2 H H S CF3 NHPh Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)Me Me H H	Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	NHC(=O)CF ₃
Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CFF2 Me Me H H 2 H H S CF3 NHMe Me Me H H 2 H H S CF3 NHMe Me Me H H 2 H H S CF3 NHMe Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)Me Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CH3 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2Ph Me Me	Me	Me	н	H	2	Н	H	S	CF ₃	NHSO ₂ Me
Me Me H H 2 H H S CF3 NHSO2CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 NHMe Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)Me Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)Me Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CH2 Me	Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₈	NHSO ₂ Ph
Me Me H H 2 H H S CF3 NHMe Me Me H H 2 H H S CF3 NHMe Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)Me Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)Ph Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CH3 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CH3 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2Me Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CF3 Me Me<	Me	Me	H	H	2	H	H	1	CF ₃	NHSO ₂ CHF ₂
Me Me H H 2 H H S CFs NHPh Me Me H H 2 H H S CFs N(Me)C(=O)Me Me Me H H 2 H H S CFs N(Me)C(=O)Ph Me Me H H 2 H H S CFs N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H 2 H H S CFs N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H 2 H H S CFs N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H 2 H H S CFs N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H 2 H H S CFs N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H 2 H H S CFs N(Me)SO2CPA Me	Me	Me	н	H	2	H	H		CF ₃	NHSO ₂ CF ₃
Me Me H H Z H H S CF3 N(Me)C(=O)Me Me Me H H Z H H S CF3 N(Me)C(=O)Ph Me Me H H Z H H S CF3 N(Me)C(=O)Ph Me Me H H Z H H S CF3 N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H Z H H S CF3 N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H Z H H S CF3 N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H Z H H S CF3 N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H Z H H S CF3 N(Me)SO2Ph Me Me H H Z H H S CF3 N(Me)SO2CF3 Me <td>Ме</td> <td>Me</td> <td>н</td> <td>H</td> <td>2</td> <td>H</td> <td>н</td> <td></td> <td>CF₃</td> <td>NHMe</td>	Ме	Me	н	H	2	H	н		CF ₃	NHMe
Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)Ph Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)Ph Me	Me	Me	H	H	2	H .	н	s	CF ₃	1 - 7
Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CH2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2Me Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CH5 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CH5 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CH5 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)Ph Me	Me	Me	H	H	2	H	H	s	CF ₃	N(Me)C(=O)Me
Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)C(=O)CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2Me Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CF3 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)Ph Me Me H H 2 H H S CF3 CI Me H <td>Me</td> <td>Me</td> <td>H</td> <td>H</td> <td>2</td> <td>H</td> <td>н</td> <td></td> <td>CF₃</td> <td>N(Me)C(=O)Ph</td>	Me	Me	H	H	2	H	н		CF ₃	N(Me)C(=O)Ph
Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2Me Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H H H S CF3 CI Me Me H	Me	Me	H	H	2	H	H		CF ₈	N(Me)C(=O)CH ₂ Ph
Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2Ph Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO2CHF2 Me Me H H 2 H H S CF3 CI Me Me H H 2 H H S CF3 CI Me Me	Me	Me	н	H	2		H		CF ₃	9
Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO ₂ CHF ₂ Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO ₂ CF ₃ Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO ₂ CF ₃ Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)Ph Me Me H H 2 H H S CF3 CN Me Me H H 2 H H S CF3 CI Me H H 2 H H S CF3 CI Me Me H H 2 H H S CF3 CI Me Me H H 2 Me H S CF3 CI Me Me H H	Me	Me	н	H	2	H			CF ₃	1
Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)SO ₂ CF ₃ Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)Ph Me Me H H 2 H H S CF3 CN Me Me H H 2 H H S CF3 CN H H H 2 H H S CF3 CI Me H H 2 H H S CF3 CI Me Me H 2 H H S CF3 CI Me Me H 2 Me H S CF3 CI Me Me H H 2 Me Me S CF3 CI Me Me H H H H S CF3 <th< td=""><td>Me</td><td>Me</td><td>H</td><td></td><td>2</td><td>ľ</td><td></td><td></td><td></td><td></td></th<>	Me	Me	H		2	ľ				
Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)2 Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)Ph Me Me H H 2 H H S CF3 CN Me Me H H 2 H H S CF3 CI Me H H 2 H H S CF3 CI Me H H 2 H H S CF3 CI Me Me H 1 2 H H S CF3 CI Me Me H H 2 Me H S CF3 CI Me Me H H 2 H H S CF3 CI Me H H 2 H H S	ì	Me		ľ	2			1	CF ₃	
Me Me H H 2 H H S CF3 N(Me)Ph Me Me H H 2 H H S CF3 CN Me Me H H 2 H H S CF3 CI Me H H H 2 H H S CF3 CI Me H H 2 H H S CF3 CI Me Me H H 2 H H S CF3 CI Me Me H H 2 Pr-i H S CF3 CI Me Me H H 2 H H S CF3 CI Me Me H H H H S CF3 CI Me H H H H H H		ì	H		1 1		i	•	ſ	1
Me Me H H 2 H H S CF3 Me Me Me H H 2 H H S CF3 CN H H H H H S CF3 Cl Me H H H H S CF3 Cl Me Me H H H S CF3 Cl Me Me H H 2 H H S CF3 Cl Me Me H H 2 Pri H S CF3 Cl Me Me H H 2 H H S CF3 Cl Me Me H H 2 H H S CF3 Cl Me H H H H H H S CF3 Cl <td< td=""><td></td><td></td><td>l I</td><td></td><td>ł I</td><td>}</td><td></td><td></td><td>i i</td><td></td></td<>			l I		ł I	}			i i	
Me Me H H 2 H H S CF3 CN H H H H H S CF3 CI Me H H H H S CF3 CI Me H H 2 H H S CF3 CI Me Me H H 2 Me H S CF3 CI Me Me H H 2 Pri H S CF3 CI Me Me H H 2 Pri H S CF3 CI Me H H 2 H H S CF3 CI Me H H H H H S CF3 CI Me H H H H H H S CF3 CI Me <t< td=""><td>1</td><td></td><td>H</td><td></td><td>2</td><td></td><td>1</td><td></td><td></td><td>N(Me)Ph</td></t<>	1		H		2		1			N(Me)Ph
H H H H 2 H H S CF3 Cl Me H Me H 2 H H S CF3 Cl Me Me Me H 2 H H S CF3 Cl Me Me Me H 2 H H S CF3 Cl Me Me Me H H 2 Me H S CF3 Cl Me Me Me H H 2 Et H S CF3 Cl Me Me H H 2 Pri H S CF3 Cl Me Me H H 2 H S CF3 Cl Me Me H H 2 H S CF3 Cl Me Me H H 2 H S CF3 Cl Me Me H H 2 H S CF3 Cl Me Et H H 2 H H S CF3 Cl Et Et H H 2 H H S CF3 Cl Me Pri H H 2 H H S CF3 Cl	l I	I.	1		1 1		1			
Me H H H 2 H H S CF3 Cl Me H Me H 2 H H S CF3 Cl Me Me H H 2 H H S CF3 Cl Me Me H H 2 Et H S CF3 Cl Me Me H H 2 Pr-i H S CF3 Cl Me Et H H 2 H H S CF3 Cl Me Et H H 2 H H S CF3 Cl Et Et H H 2 H H S CF3 Cl Me Pr-i H H S CF3 Cl		i i			2	}				1
Me H Me H 2 H H S CF3 Cl Me Me H 2 H H S CF3 Cl Me Me H H 2 Me H S CF3 Cl Me Me H H 2 Pr-i H S CF3 Cl Me Me H H 2 H H S CF3 Cl Me Et H H 2 H H S CF3 Cl Et Et H H 2 H H S CF3 Cl Me Pr-i H H H S CF3 Cl		1	1 1		2		ł			
Me Me H 2 H H S CF3 Cl Me Me H H 2 Me H S CF3 Cl Me Me H H 2 Et H S CF3 Cl Me Me H H 2 Pr-i H S CF3 Cl Me Et H H 2 H H S CF3 Cl Et Et H H 2 H H S CF3 Cl Me Pr-i H H H S CF3 Cl	ì		1 1		1 3		i .		1	
Me Me H H 2 Me H S CF3 Cl Me Me H H 2 Et H S CF3 Cl Me Me H H 2 Pr-i H S CF3 Cl Me Et H H 2 H H S CF3 Cl Et Et H H 2 H H S CF3 Cl Me Pr-i H H H S CF3 Cl					1 1		i .	S		,
Me Me H H 2 Et H S CF3 Cl Me Me H H 2 Pr-i H S CF3 Cl Me Me H H 2 Me Me S CF3 Cl Me Et H H 2 H H S CF3 Cl Et Et H H 2 H H S CF3 Cl Me Pr-i H H 2 H H S CF3 Cl		l .			ı ı					
Me Me H H 2 Pr-i H S CF3 CI Me Me H H 2 Me Me S CF3 CI Me Et H H 2 H H S CF3 CI Et Et H H 2 H H S CF3 CI Me Pr-i H H L H H S CF3 CI		1			, ,		3			
Me Me H H 2 Me Me S CF3 Cl Me Et H H 2 H H S CF3 Cl Et Et H H 2 H H S CF3 Cl Me Pr-i H H 2 H H S CF3 Cl			l I			İ				
Me Et H H 2 H H S CF3 Cl Et Et H H 2 H H S CF3 Cl Me Pr-i H H 2 H H S CF3 Cl		i .	H		2		1	- 1		1
$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	Me	Me	H	H	2		•	S	CF3	CI
Me Pr-i H H 2 H H S CF3 Cl	Me	Et	H	H	2		H	s	CF ₃	C1
	Et	Et	H	H	2		Н	s	CF ₃	CI
lMalpalulululu le lora lor	Me	Pr-i	H	H	2	H	H	s	CF ₃	C1
	Me	Pr ·	H	H	2	H	н	s	CF ₈	Cl
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	Me	Pr-c	H	H	2	H	н	S	CF ₃	C1
Me CH ₂ Pr-c H H 2 H H S CF ₃ Cl	Me	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	н	S	CF ₃	CI

			1			ı	1.	1	l
1	CH ₂) ₂ -	H	H	2	H	H	S	CF ₈	CI
ſ	CH ₂) ₃ -	H	H	2	H	H	S	CF ₈	C1
-(0	CH ₂) ₄ -	H	H	2	H	H	s	CF ₃	CI
-(CH ₂) ₅ -	H	H	2	H	H	s	CF ₃	C1
Н	-(CH ₂)	8*	H	2	H	н	S	CF ₃	CI
н	-(CH ₂)	4"	H	2	H	н	s	CF ₃	CI
н	-(CH ₂)	5-	H	2	H	н	s	CF ₃	C1
Н	-(CH ₂)	6-	H	2	H	н	s	CF ₃	cı
Me	Me	H	H	1	H	н	О	Me	F
Me	Me	Н	H	1	H	н	0	Me	CI
Me	Me	H	H	1	H	н	0	Me	ОМе
Me	Me	H	Н	1	H	H	О	Me	OEt
Me	Me	H	Н	1	H	H	О	Me	OPr-i
Me	Me	Н	H	1	H	н	0	Me	OPh
Me	Me	H	Н	1	H	н	О	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	н	О	Me	Me
Me	Ме	H	H	1	H	н	О	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	О	Me	CN
Me	Ме	H	H	1	H	H	О	OCHF ₂	F
Me	Ме	H	H	1	H	H	0	OCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	н	0	OCHF ₂	Ме
Me	Me	H	H	1	H	H	О	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	0	OCHF ₂	CN
Me	Me	H	Н	1	H	H	0	CF ₃	F
Me	Me	H	Н	1	H	H	О	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	О	CF ₈	OMe ⁻
Me	Me	H	н	1	H	H	0	CF ₃	OEt
Me	Ме	H	Н	1	H	H	О	CF ₈	OPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	0	CF ₈	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	0	CF ₃	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	0	CF ₈	SMe
Me	Me	H	Н	1	H	н	Ю	CF ₈	SO ₂ Me
Me	Me	H	H	1	H	H	0	CF ₃	SEt
Me	Me	H	H	1	H	H	О	CF ₃	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	1	H	H	0	CF3	SPr-i
Me	Me	H	Н	1	H	н	0	CF ₃	SO ₂ Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	0	CF ₃	SPh
Me	Me	H	H	1	H	н	0	CF ₃	SO₂Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	0	CF3	SCHF ₂
Me	Me	H	Н	1	н	Н	О	CF ₃	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Н	1	H	н	0	CF ₃	SCF ₈
Me	Me	H	H	1	H	H	0	CF_3	SO ₂ CF ₃

1 - 1 - 2 - 2 - 2 - 2 - 2 - 2 - 2 - 2 -			_		•				_
Me	Me	H	H	1	H	н	0	CF ₃	NH ₂
Me	Me	Н	H	1	H	н	0	CF ₃	NHC(=0)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	0	CF ₃	NHC(=O)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	0	CF ₃	NHC(=0)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	0	CF ₃	NHC(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	н	Ю	CF ₃	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	1	H	н	Ю	CF ₃	NHSO2Ph
Ме	Me	H	H	1	H	H	О	CF ₃	NHSO ₂ CHF ₂
Me	Me	н	H	1	H	н	Ю	CF ₃	NHSO2CF3
Me	Me	H	H	1	H	н	О	CF ₃	NHMe
Me	Me	н	H	1	H	н	Ю	CF ₃	NHPh
Me	Me	H	H	1	H	н	Ю	CF ₃	N(Me)C(=O)Me
Ме	Me	H	H	1	H	н	О	CF ₃	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	1	H	н	О	CF ₃	N(Me)C(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	н	H	1	H	н	0	CF ₃	N(Me)C(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	н	О	CF ₃	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	1	H	н	0	CF ₃	N(Me)SO₂Ph
Ме	Me	H	H	1	H	H	О	CF ₃	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Me	н	H	1	H	H	О	CF ₃	N(Me)SO ₂ CF ₃
Ме	Me	H	н	1	H	н	0	CF ₃	N(Me) ₂
Me	Me	Н	H	1	H	H	О	CF ₃	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	Н	0	CF ₈	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	О	CF ₈	CF ₈
Me	Me	H	H	1	H	H	О	CF ₃	CN
Me	Me	H	H	1	H	н	O	Ph	Me
н	H	H	H	1	H	H	0	CF ₈	Me
Me	н	H	H	1	H	н	0	CF ₃	Me
Me	H	Me	H	1	H	H	0	CF ₃	Me
Me	Me	Me	H	1	H	H	0	CF ₈	Me
Me	Me	H	H	1.	Me	H	0	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	Et	H	0	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	0	CF ₈	Me
Me	Me	H	H	1	Me	Me	0	CF ₃	Me
Ме	Et	H	H	1	H	H	0	CF ₃	Me
Et	Et	H	H	1	H	H	0	CF ₈	Me
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	0	CF ₈	Me
Me	Pr	H	H	1	H .	H	0	CF ₃	Ме
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	О	CF ₃	Me
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	н	О	CF ₃	Me
	CH ₂) ₂ -	H	H	1	H	H	0	CF ₃	Me
-(4	CH ₂) ₃ -	H	H	1	H	н	О	CF ₃	Me
-(0	CH ₂) ₄ -	Н	Н	1	н	H	o	CF ₃	Me

WO 02/062770 PCT/JP02/01015

-((CH2)5-	н	н	1	н	н	Ю	$ _{\mathrm{CF}_3}$	Me
Н	-(CH ₂)	8-	Н	1	Ħ	н	О	CF3	Me
н	-(CH ₂)	1	H	1	H	H	o	CF ₃	Me
н	-(CH ₂)		н	1	н	н	0	CF ₃	Me
H	-(CH ₂)		Н	$ _{1} $	н	н	o	CF ₈	Me
Me	Me	H	H	1	H	н	s	Me	F
Me	Me	H	H	1	H	H	s	Me	cı
Me	Me	Н	H	1	H	н	s	Me	ОМе
Me	Me	Н	H	1	H	н	s	Me	OEt
Me	Me	н	H	1	н	н	s	Me	OPr-i
Me	Me	н	H	1	H	H	s	Me	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	s	Me	OCHF ₂
Me	Me	н	H	1	H	H	s	OCHF ₂	F
Me	Me	H	H	1	H	н	s	OCHF ₂	Cı
Me	Me	H	H	1	H	н	s	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	s	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	s	OCHF ₂	CN
Me	Me	H	H	1	H	н	s	CF ₃	F
Me	Ме	H	H	1	H	H	s	CF ₃	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	s	CF ₃	ОМе
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	OEt
Me	Me	Η	H	1	H	H	S	CF ₃	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₈	SMe
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₈	SO ₂ Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₈	SEt
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₈	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	s s	CF ₃	SO₂Pr-i SPh
Me Me	Me	H	H	$\begin{vmatrix} 1 \\ 1 \end{vmatrix}$	H	H	S	CF ₃	SO ₂ Ph
Me	Me Me	Н	H	1	H	H	S	CF ₃	SCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SCF ₈
Me	Me	H	н		н	H	S	CF ₃	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	Н	H	S	CF ₈	NH ₂
Me	Me	H	Н	1	H	Н	S	CF ₃	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	1	н	H	s	CF ₃	NHC(=0)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₈	NHC(=0)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	н	H	s	CF ₃	NHC(=0)CF ₈
Me	Me	H	H	1	н	H	s	CF ₃	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	Н	1	1	H	S	CF ₃	NHSO2Ne NHSO2Ph
INTE	IATE	l u	l u	1+	l u	l 12	b	lor a	TATIONAL II

							,	r	ť
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	NHSO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	s	CF ₃	NHSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₈	NHMe
Me	Me	H	H	1	н	H	s	CF ₃	NHPh
Me	Me	H	H	1	н	H	s	CF ₃	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	s	CF ₈	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	н	H	1	н	H	S	$\mathbf{CF_8}$	N(Me)C(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	Ħ	s	CF ₃	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	н	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	н	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me) ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me)Ph
Me	Me	н	H	1	H	H	S	CF ₃	Me
Me	Me	н	H	1	H	H	s	CF ₈	CN
н	H	н	н	1	H	H.	s	CF ₃	CI
Me	н	н	H	1	H	H	S	CF3	C1
Me	H	Me	н	1	H	Н	s	CF ₃	Cl
Me	Me	Ме	H	1	H	H	s	CF ₃	C1
Me	Me	H	н	1	Me	H	s	CF ₃	CI
Me	Me	н	H	1	Et	H	s	CF ₈	Cl
Me	Me	н	н	1	Pr•i	H	s	CF ₃	C1
Me	Me	н	H	1	Me	Me	s	CF3	Cl
Me	Et	н	Н	1	H	H	s	CF ₃	CI
Et	Et	Н	H	1	H	H	s	CFs	CI
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	s	CF ₃	Cl
Me	Pr	н	H	1	H	н	S	CF ₃	CI
Ме	Pr-c	H	H	1	H	H	s	CF ₃	CI
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	s	CF ₈	C1
-($CH_2)_2$ -	H	H	1	H	н	s	CF ₃	CI
-(CH ₂) ₃ -	н	H	1	н	н	S	CF ₃	Cl
<u> </u>	CH ₂) ₄ -	н	H	1	н	H	s	CF ₈	C1
ı	CH ₂) ₅ -	H	Н	1	н	H	s	CF ₃	Cl
H	-(CH ₂)8-	H	1	H	н	ន	CF ₃	Cl
н	-(CH2)4-	H	1	H	н	ន	CF ₃	CI
н	-(CH2) ₅ -	Н	1	н	н	s	CF ₃	Cl
н	-(CH ₂) ₆ -	H	1	н	H	s	CF ₃	CI
Me	Me	H	H	0	H	н	0	Me	F
Me	Me	H	H	0	н	H	0	Me	CI
Me	Me	H	H	0	H	H	0	Me	ОМе
Me	Me	H	Н	0	н	H	0	Me	OEt

WO 02/062770 PCT/JP02/01015

Me	Me	H	H	0	H	н	0	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	0	H	н	О	Me	OPh
Me	Me	H	H	0	H	н	0	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	0	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	н	0	Me	CF ₈
Me	Me	H	H	0	H	H	0	Me	CN
Me	Me	H	H	0	H	н	О	OCHF ₂	F
Me	Me	H	Н	0	H	н	О	OCHF ₂	CI
Me	Me	H	H	0	H	н	0	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	0	OCHF ₂	CF ₈
Me	Me	H	Н	0	H	н	0	OCHF ₂	CN
Me	Me	H	H	0	H	н	О	CF ₃	F
Me	Me	H	H	0	H	H	О	CF ₈	Cı
Me	Me	H	H	0	H	H	О	CF ₈	ОМе
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₈	OEt
Me	Me	H	H	0	H	н	О	CF ₃	OPr-i
Me	Me	H	Н	0	H	H	О	CF ₃	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	О	CF ₃	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₈	SMe
Me	Me	H	Н	0	H	H	О	CF ₃	SO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	О	CF ₃	SEt
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₃	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₈	SPr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	О	CF ₃	SO ₂ Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	О	CF ₃	SPh
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₃	SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₃	SCHF ₂
Ме	Me	H	H	0	H	H	О	CF ₃	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₃	SCF ₈
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₃	SO ₂ CF ₈
Me	Me	H	H	0	H	H	Ю	CF ₃	NH ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₃	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₃	NHC(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	Ю	CF ₃	NHC(=0)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF_8	NHC(=O)CF ₈
Me	Me	H	H	0	H	Н	0	CF ₃	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₃	NHSO ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	Н	0	CF ₃	NHSO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₃	NHSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₈	NHMe
Me	· Me	H	H	0	H	H	0	CF ₈	NHPh
Me	Me	H	H	0	H	н	o	CF ₃	N(Me)C(=O)Me
Ме	Me	H	H	0	H	H	О	CF ₈	N(Me)C(=O)Ph

Me Me H H O CFs N(Me)C(=) Me Me H H O CFs N(Me)C(=) Me Me H H O CFs N(Me)C(=) Me Me H H O CFs N(Me)SO2 Me Me H H O CFs Me Me Me H H	
Me Me H H 0 H H 0 CF3 N(Me)C(= Me Me H H 0 H H 0 CF3 N(Me)SO2 Me Me H H 0 H H 0 CF3 N(Me)SO2 Me Me H H 0 H H 0 CF3 N(Me)SO2 Me Me H H 0 H H 0 CF3 N(Me)SO2 Me Me H H 0 H H 0 CF3 N(Me)SO2 Me Me H H 0 H H 0 CF3 N(Me)SO2 Me Me H H 0 H H 0 CF3 N(Me)SO2 Me Me H H 0 H H 0 CF3 N(Me)Ph Me Me H <td>))CH₂Ph</td>))CH₂Ph
Me Me H H O H H O CF3 N(Me)SO2 Me Me H H O CF3 N(Me)Ph Me Me H H O CF3 Me Me H H H O CF3 Me Me H H </td <td>O)CF3</td>	O)CF3
Me Me H H 0 H H O CF3 N(Me)SO2 Me Me H H 0 H H O CF3 N(Me)SO2 Me Me H H 0 H H O CF3 N(Me)SO2 Me Me H H 0 H H O CF3 N(Me)SO2 Me Me H H 0 H H O CF3 N(Me)SO2 Me Me H H 0 H H O CF3 N(Me)Ph Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me H H 0 H <td>Мe</td>	Мe
Me Me H H 0 H H O CF3 N(Me)SO2 Me Me H H 0 H H O CF3 N(Me)Ph Me Me H H 0 H H O CF3 N(Me)Ph Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me H H 0 H H O CF3 <td>Ph</td>	Ph
Me Me H H 0 H H O CF3 N(Me)2 Me Me H H 0 H H O CF3 N(Me)2 Me Me H H 0 H H O CF3 N(Me)Ph Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me Me H H 0 H H O CF3 CN Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me Me H 0 H H O CF3 Me Me Me H H 0 Me Me O	CHF ₂
Me Me H H 0 H H O CFs N(Me)Ph Me Me H H 0 H H O CFs Me Me Me H H 0 H H O CFs CFs Me Me H H 0 H H O CFs Me Me H H 0 H H O CFs Me Me H H 0 H H O CFs Me Me H H 0 H H O CFs Me Me Me H H 0 H H O CFs Me Me Me H H 0 Me H O CFs Me Me Me H H 0 H H O	CF ₈
Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me Me H H 0 H H O CF3 CF3 Me Me H H 0 H H O CF3 CF3 Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me Me H H 0 H H O CF3 Me Me Me H H 0 Me H O CF3 Me Me Me H H 0 Me Me O CF3 Me Me Me H H 0 H H <	
Me Me H H 0 H H O CFs CFs Me Me H H 0 H H O CFs CN Me Me H H 0 H H O CFs Me Me H H H O CFs Me Me<	
Me Me H H 0 H H O CFs CN Me Me H H 0 H H O CFs Me Me H H H O CFs Me Me Me H H O H H O CFs Me Me Me H O H H O CFs Me Me Me H H O Me H O CFs Me Me Me H H O Me H O CFs Me Me Me H H O Me Me<	
Me Me H H 0 H H O CFs Me H H H H H O CFs Me Me H H H O CFs Me Me H H O H H O CFs Me Me Me H H O H H O CFs Me Me Me H H O Me H O CFs Me Me Me H H O Me Me O CFs Me Me Me H H O H H O CFs Me Me Me H H O H H O CFs Me Me Pri H H H H O CFs Me Me	
H H H H O H H O CF3 Me Me H H H O H H O CF3 Me Me Me H Me H O H H O CF3 Me Me Me Me H O H H O CF3 Me Me Me Me H H O Me H O CF3 Me Me Me Me H H O TF1 H O CF3 Me Me Me Me H H O Me Me O CF3 Me Me Me Me H H O Me Me O CF3 Me Me Me H H O H H O CF3 Me Me Me H H O H H O CF3 Me Me Me TF1 H H O H H O CF3 Me Me PT1 H H O H H O CF3 Me Me PT2 H H O H H O CF3 Me Me CH2PT2 H H O H H O CF3 Me -(CH2)5 H H O H H O CF3 Me -(CH2)5 H H O H H O CF3 Me -(CH2)5 Me	
Me H H H O CF3 Me Me H Me H O H H O CF3 Me Me Me Me H O H H O CF3 Me Me Me H H O Me H O CF3 Me Me Me H H O Me H O CF3 Me Me Me H H O Me	
Me H Me H 0 H H O CF3 Me Me Me Me H 0 H H O CF3 Me Me Me H H 0 Me H O CF3 Me Me Me H H 0 Pri H O CF3 Me Me Me H H 0 Me Me <td></td>	
Me Me H 0 H H O CFs Me Me Me H H O CFs Me Me Et H H O H H O CFs Me Me Pri H H H H O CFs Me Me Pro H H O H H O CFs Me Me CH2Pro H H O H H O CFs Me -(CH2)2- H H O H H O CFs Me	
Me Me H H O CF3 Me Me Me H H O CF3 Me Me Me H H O CF3 Me Me Me H H O CF3 Me Me Me H H O CF3 Me Me Pri H H O CF3 Me Me Pri H H O CF3 Me Me Pro H H O CF3 Me Me Pro H H O CF3 Me Me CH2Pro H H O CF3 Me -(CH2)2- H H O H H O CF3 Me -(CH2)3- H H O H H O CF3 Me	
Me Me H H 0 Et H O CF3 Me Me Me Me H H O CF3 Me Me Me Me Me O CF3 Me Me Et H H O H H O CF3 Me Me Pri H H O H H O CF3 Me Me Pri H H H H O CF3 Me Me Pri H H H H O CF3 Me Me CH2Pric H H O H H O CF3 Me -(CH2)2 H H O H H O CF3 Me	
Me Me H H O Pri H O CF3 Me Me Me Me Me Me O CF3 Me Me Et H H 0 H H O CF3 Me Me Pri H H 0 H H O CF3 Me Me Pr H H 0 H H O CF3 Me Me Prc H H 0 H H O CF3 Me Me CH2Prc H H 0 H H O CF3 Me -(CH2)2- H H 0 H H O CF3 Me	
Me Me H H 0 Me Me O CF3 Me Me Et H H 0 H H O CF3 Me Et Et H H 0 H H O CF3 Me Me Pr-i H H 0 H H O CF3 Me Me Pr-c H H 0 H H O CF3 Me Me CH2Pr-c H H 0 H H O CF3 Me -(CH2)2- H H 0 H H O CF3 Me -(CH2)3- H H 0 H H O CF3 Me	
Me Et H H O CF3 Me Et Et H H O CF3 Me Me Pri H H O CF3 Me Me Pri H H O CF3 Me Me Pro H H O CF3 Me Me CH2Pro H H O CF3 Me -(CH2)2- H H O H H O CF3 Me -(CH2)3- H H O H H O CF3 Me	
Et Et H H O CF3 Me Me Pri H H O CF3 Me Me Pr H H O CF3 Me Me Prc H H O CF3 Me Me CH2Prc H H O CF3 Me -(CH2)2- H H O H H O CF3 Me -(CH2)3- H H O H H O CF3 Me	
Me Pri H H 0 H H O CF3 Me Me Pr H H 0 H H O CF3 Me Me Pr-c H H 0 H H O CF3 Me Me CH2Pr-c H H 0 H H O CF3 Me -(CH2)2- H H 0 H H O CF3 Me -(CH2)3- H H 0 H H O CF3 Me	
Me Pr H H 0 H H O CF3 Me Me Pr-c H H 0 H H O CF3 Me Me CH2Pr-c H H 0 H H O CF3 Me -(CH2)2- H H 0 H H O CF3 Me -(CH2)3- H H 0 H H O CF3 Me	
Me Pr-c H H O H H O CF3 Me Me CH2Pr-c H H O H H O CF3 Me -(CH2)2- H H O H H O CF3 Me -(CH2)3- H H O H H O CF3 Me	
Me CH ₂ Pr-c H H O H H O CF ₃ Me -(CH ₂) ₂ - H H O H H O CF ₃ Me -(CH ₂) ₃ - H H O H H O CF ₃ Me	
-(CH ₂) ₂ - H H O H O CF ₃ Me -(CH ₂) ₃ - H H O H O CF ₃ Me	
-(CH ₂) ₃ - H H O H H O CF ₃ Me	
1 1 1 1	
-(CH ₂) ₄ - H H O H H O CF ₈ Me	
-(CH ₂) ₅ - H H O H H O CF ₃ Me	
H -(CH ₂) ₃ - H O H H O CF ₃ Me	
H -(CH ₂) ₄ - H O H H O CF ₃ Me	
H -(CH ₂) ₅ - H O H H O CF ₃ Me	
H -(CH ₂) ₆ - H O H H O CF ₃ Me	
Me Me H H OMe Me Me H H H S Me OEt	
Me Me H H O H H S Me OPH	
Me Me H H O H H S Me OCHF2	
Me Me H H O H H S OCHF ₂ F	

l	Me	Me	H	н	ol	н	H	s	OCHF ₂	Cl
ĺ	Me	Me	н	H	0	н	H	s	OCHF ₂	Me
l	Me	Me	н	н	0	н	H	s	OCHF ₂	CF ₃
ļ	Me	Me	H	H	0	н	H	s	OCHF ₂	CN
l	Me	Me	H	н	o	н	H	s	CF ₃	F
١	Me	Me	н	H	0	н	H	s	CF ₃	Cl
ĺ	Me	Me	Н	Н	ol	н	H	s	CF ₃	OMe
l	Me	Me	н	H	ol	н	H	s	CF ₃	OEt
l	Ме	Me	н	H	lol	н	H	s	CF_3	OPh
١	Me	Me	н	H	o	H	H	s	CF ₃	OCHF2
Ì	Me	Me	H	Н	0	н	H	s	CF ₃	SMe
l	Me	Me	н	Н	o	H	H	s	CF ₃	SO ₂ Me
1	Me	Me	н	Н	o	н	H	s	CF ₃	SEt
١	Me	Me	н	Н	o	н	H	s	CF ₃	SO₂Et
l	Me	Me	Н	H	o	н	H	s	CF ₃	SPr-i
l	Me	Me	н	Н	0	н	н	s	CF ₃	SO ₂ Pr-i
١	Me	Me	н	Н	0	н	H	s	CF ₃	SPh
١	Me	Me	н	Н	0	н	H	s	CF ₃	SO ₂ Ph
l	Me	Me	н	н	0	H	H	s	CF ₃	SCHF ₂
1	Me	Me	н	H	0	н	H	s	CF ₃	SO ₂ CHF ₂
l	Me	Me	н	н	0	H	H	s	CF ₃	SCF ₃
١	Me	Me	н	H	0	н	H	S	CF ₃	SO ₂ CF ₈
١	Me	Me	Н	н	o	Н	H	S	CF ₈	NH ₂
I	Me	Me	Н	H	0	H	H	s	CF ₃	NHC(=O)Me
l	Me	Me	н	H	0	H	H	s	CF ₃	NHC(=O)Ph
l	Me	Me	н	н	0	H	H	s	CF ₃	NHC(=O)CH ₂ Ph
ĺ	Me	Me	H	Н	0	H	H	s	CF ₃	NHC(=O)CF ₃
	Me	Me	н	H	0	H	Н	s	CF ₃	NHSO ₂ Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	s	CF ₃	NHSO ₂ Ph
İ	Me	Me	H	H	0	H	Н	s	CF ₈	NHSO ₂ CHF ₂
	Me	Me	H	H	0	H	H	s	CF ₃	NHSO ₂ CF ₃
	Ме	Me	H	H	0	H	H	s	CF ₃	NHMe
ļ	Ме	Me	н	H	0	H	н	S	CF ₃	NHPh
1	Me	Me	H	H	0	H	H	s	CF ₃	N(Me)C(=O)Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	s	CF ₈	N(Me)C(=O)Ph
	Me	Me	H	H	0	H	н	s	CF ₃	N(Me)C(=O)CH ₂ Ph
	Me	Me	H	H	0	H	н	s	CF ₃	N(Me)C(=O)CF ₃
	Me	Me	H	H	0	н	н	s	CF ₃	N(Me)SO ₂ Me
ļ	Me	Me	Н	H	0		н	s	CF ₈	N(Me)SO ₂ Ph
	Me	Me	H	Н	0		н	s	CF ₃	N(Me)SO ₂ CHF ₂
	Me	Me	Н	H	0	H	Н	s	CF ₃	N(Me)SO ₂ CF ₃
	Me	Me	H	H	0	i	н	s	CF₃	N(Me)2
	Me	Me	Н	H	0		H	S	$\mathbf{CF_3}$	N(Me)Ph
		1	1	1	1	1	I	1 "	,	, ,

Me	Me	н	H	0	н	H	s	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	s	CF₃	CN
H	H	н	H	0	H	H	s	CF ₃	Cl
Me	H	H	H	0	H	H	s	CF3	Cl
Me	H	Ме	H	0	H	H	s	CF ₈	C1
Me	Me	Ме	H	0	H	H	s	CF3	C1
Me Me		H	н	0	Me	H	s	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	Et	H	s	CF ₃	CI
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	s	CF ₃	Cl
Me	Me	н	H	0	Me	Me	s	CF ₈	Cl
Me	Et	H	H	0	H	H	s	CF3	Cl
Et	Et	н	H	0	H	H	S	CF_8	C1
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	S S	CF ₃	CI
Me	Pr	H	н	0	H	H		CF ₃	C1
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	s	CF ₃	C1
Me	Me CH ₂ Pr-c		Н	0	H	H	s	CF ₈	C1
-(CH ₂) ₂ -		H	H	0	H	H	s	CF ₃	Cl
-(CH ₂) ₃ -		H	н	0	H	H	S	CF ₃	C1
-(CH ₂) ₄ -		H	н	0	H	H	s	CF ₃	Cl
-(CH ₂) ₅ -		н	н	0	н	н	s	CF ₃	C1
H -(CH ₂):		3-	Н	0	H	H	s	CF ₃	CI
H -(CH ₂)		4-	н	0	н	н	s	CF ₈	CI
H -(CH ₂)) ₅ -	н	0	Н	H	s	CF ₃	Cl
н	-(CH ₂)		н	0	н	H	s	CF ₃	CI

表5

	$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$														
R1	R ²	R ³	R4	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁴	R ³³	R ³⁴						
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	Н						
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	Me						
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	Et						
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	CI	CF ₈						
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	CF ₈	H						
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	CF ₃	Ме						
Ме	Me	н	H	2	н	Н	NMe	OCHF ₂	H						
Me	Me	н	H	2	н	H	NMe	OCHF ₂	Me						
Me	Me	H	H	2	н	н	NMe	C(=O)Me	H						
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	C(=O)Me	Ме						
Me	Me	H	H	2	Н	H	NMe	l l	CH ₂) ₈ -						
Me	Me	H	H	2	н	H	NMe	-((CH ₂) ₄ -						
Me	Me	H	H	2	н	H	NEt	Cl	Me						
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	CF ₈	H						
Me	Me	H	н	2	н	H	NEt	CF ₃	Me						
Me	Me	H	H	2	Н	н	NEt	OCHF ₂	H						
Me	Me	H	Н	2	н	H	NEt	OCHF ₂	Me						
Me	Me	н	Н	2	н	н	NEt	-((CH ₂) ₈ -						
Me	Me	H	н	2	н	H	NEt	-((CH ₂) ₄ -						
Me	Me	H	Н	2	Н	H	NPr-i	Cl	Me						
Me	Me	H	Н	2	н	н	NPr-i	CF ₃	н						
Me	Me	н	н	2	Н	н	NPr-i	CF ₃	Me						
Me	Me	H	H	2	Н	H	NPr-i	OCHF ₂	н						
Me	Me	H	H	2	Н	H	NPr-i	OCHF ₂	Me						
Me	Me	H	Н	2	Н	l	NPr-i		CH ₂) ₃ -						
Me	Me	H	Н	2	Н	H	NPr-i	4	CH₂)₄-						
Me	Me	H	н	2	H	H	NPr	Cl	Me						
Me	Me	H	Н	2	H	H	NPr	CF ₈	Н						
Me	Me	Н	Н	2	H	ŀ	NPr	CF ₃	Me ·						
Me	Me	н	H	2	Н		NPr	OCHF ₂	н						
Me	Me	Н	H	2	H	н	NPr	OCHF ₂	Me						
I TATE	1476	1 "	1 **	1 -	1 **	1 **		100 "	1						

Me	Me	н	н	2	н	Н	NPr	-(C	H ₂) ₈ -
Ме	Me	н	H	2	H	H	NPr	-(0	H ₂) ₄ -
Ме	Me	н	H	2	H	H	NBu-t	Cl	Me
Ме	Me	H	н	2	H	H	NBu-t	CF ₃	н
Me	Me	H	н	2	н	H	NBu-t	CF ₃	Me
Ме	Me	H	н	2	н	H	NBu-t	OCHF ₂	н
Ме	Me	н	н	2	н	H	NBu-t	OCHF ₂	Ме
Me	Me	H	H	2	н	Н	NBu-t	-(C	H ₂) ₃ -
Me	Me	H	H	2	н	H	NBu-t	-(0	H ₂) ₄ -
Ме	Me	н	н	2	н	H	NCH₂Ph	Cl	Ме
Me	Me	H	H	2	н	н	NCH₂Ph	CF ₃	н
Ме	Me	н	н	2	н	H	NCH₂Ph	OCHF2	н
Ме	Me	н	H	2	н	H	NCH₂OMe	Cı	Me
Ме	Me	н	н	2	н	Н	NCH ₂ OMe	CF ₃	н
Me	Me	н	н	2	н	H	NCH ₂ OMe	OCHF2	н
Ме	Me	H	H	2	н	H	NCH2C≡CH	Cı	Ме
Me	Me	н	H	2	н	H	NCH ₂ C≡CH	CF ₃	н
Me	Me	н	н	2	н	H	NCH ₂ C≡CH	OCHF ₂	н
Me	Me	н	H	2	н	H	NCH ₂ CH=CH ₂	Cı	Ме
Me	Me	H	н	2	н	H	NCH ₂ CH=CH ₂	CF ₈	н
Ме	Me	н	H	2	н	H	NCH ₂ CH=CH ₂	OCHF ₂	н
Ме	Me	н	H	2	н	H	NCHF ₂	Cı	Me
Me	Me	н	H	2	Н	н	NCHF ₂	CF3	н
Me	Me	н	H	2	н	н	NCHF ₂	CF ₃	Me .
Ме	Me	H	H	2	H.	H	NCHF2	OCHF ₂	н
Ме	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	н	Н	NCHF ₂	C(=O)Me	Н
Me	Мe	H	H	2	н	н	NCHF ₂	C(=O)Me	Ме
Ме	Me	H	H	2	н	н	NCHF2	-(C	H ₂) ₃ -
Ме	Me	н	H	2	н	н	NCHF₂	-(0	H ₂) ₄ -
Ме	Me	Н	H	2	H	Н	NPh	OMe	Me
Ме	Me	H	H	2	H	H	NPh	OEt	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	Н	2	H	H	NPh	OCH ₂ CF ₈	Me
Me	Me	H	н	2.	H	H	NPh	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OCH ₂ CH=CH ₂	1
Me	Me	H	H	2	H	н	NPh	l .	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	C1	Me Mo
Me	Me	H	H	2	H	H	N(2-Cl)Ph	jc1	Me

Me	Me	H	н	2	н	H	N(2-F)Ph	lc1	Ме
Me	Me	н	H	2	H	H	N(2-OMe)Ph	CI	Me
Me	Me	н	H	2	H	H	N(2-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	н	H	2	H	H	N(3-Cl)Ph	Cı	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(3-F)Ph	CI	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(3-OMe)Ph	C1	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(3-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(4-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(4-F)Ph	C1	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(4-OMe)Ph	Cl	Me
Me Me	Me Me	H	H H	2 2	H H	H	N(4-Me)Ph N(Thiophen-2-yl)	C1 C1	Me Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(Thiophen 2 yl)	CF ₈	H
Me	Me	H	H	2	Н	Н	N(Thiophen 2-yl)	OCHF ₂	H
1							1 -	i .	1
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=0)Me	Cl	Me
Me	Ме	H	H	2	H		NC(=O)Me	CF ₈	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Me	OCHF ₂	H
Ме	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)CF ₈	C1	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)CF3	CF ₃	H
Ме	Ме	H	H	2	H	H	NC(=O)CF ₈	OCHF2	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)CH2Ph	Cı	Me
Ме	Ме	H	H	2	H	H	NC(=O)CH ₂ Ph	CF ₈	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)CH2Ph	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Ph	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	Н	H	NC(=O)Ph	OCHF2	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=0)OMe	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=0)OMe	OCHF2	н
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=0)OCH₂Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=0)OCH ₂ Ph	CF ₃	н
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=0)OCH2Ph	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	Н	NC(=O)OPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=0)OPh	CF ₃	н
Me	Ме	H	H	2	H	H	NC(=0)OPh	OCHF2	н
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=0)NHMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=0)NHMe	CF ₈	н
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=0)NHMe	OCHF2	н
Me	Me	н	н	2	H	H	NC(=0)N(Me)2	C1	Ме
Me	Me	н	Н	2	H	H	NC(=0)N(Me)2	CF ₃	н
Me	Me	H	H	2	н	H	NC(=0)N(Me)2	OCHF2	н
H	Н	H	H	2	н			CI	Me
Me	н	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me

Me	н	Me	н	2	н	н	NPh	lcı	Me
Me	Me	Н	H	2	Me	H	NPh	C1	Me
Me	Me	H	H	2	Et	H	NPh	CI	Me
Me	Me	H	H	2	Pri	H	NPh	C1	Me
Me	Me	н	H	2	Me	Me	NPh	Cl	Me
Me	Et	н	н	2	н	H	NPh	Cl	Me
Et	Et	н	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr-i	H	H	2	н	H	NPh	Cl	Me
Me	\mathbf{Pr}	H	H	2	H	H	NPh	C1	Me
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	NPh	Cı	Me
Me	CH ₂ Pr-c	H	н	2	н	H	NPh	C1	Me ,
-((CH ₂) ₂ -	н	H	2	H	H	NPh	CI	Me
-((CH ₂) ₃ -	H	H	2	H	н	NPh	CI	Me
	(CH ₂) ₄ -	H	H	2	H	Н	NPh	CI	Me
	(CH ₂) ₅ -	H	H	2	н	H	NPh	C1	Me
H	-(CH ₂)3-	H	2	H	H	NPh	CI	Me
H	-(CH ₂)4-	H	2	н	Н	NPh	CI	Me
H	-(CH ₂)5-	H	2	н	H	NPh	[C1	Me
H	-(CH ₂		H	2	н	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	Ме
Me	Me	H	H	2	H	H	0	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	Me
Me	Me	H	H H	2 1	H	H	S NMe	CI CI	Me H
Me Me	Me Me	H	H	1	н	H	NMe	Ci	Me
Me	Me	H	H	1	н	H	NMe	ci	Et
Me	Me	H	Н	1	Н	н	NMe	CI	CF ₈
Me	Me	H	н	1	н	н	NMe	CF ₃	H
Me	Me	H	н	1	H	н	NMe	CF ₃	Me
Me	Me	н	Н	1	н	н	NMe	OCHF2	н
Me	Me	н	н	1	н	н	NMe	OCHF2	Me
Me	Me	H	н	1	H	н	NMe	C(=O)Me	H
Me	Me	H	н	1	H	H	NMe	C(=O)Me	Me
Me	Me	н	н	1	н	н	NMe	-(CH ₂) ₃ -
Me	Me	H	н	1	H	н	NMe	-(CH ₂) ₄ -
Me	Me	H	н	1	H	н	NEt	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	н	н	NEt	CF ₃	н
Me	Me	н	н	1	н	H	NEt	CF ₈	Ме
Me	Me	H	н	1	н	H	NEt	OCHF2	H
Me	Me	H	н	1	H	н	NEt	OCHF2	Мө
Me	Me	H	н	1	Н	H	NEt	-(CH ₂) ₃ -
Me	Me	H	н	1	H	H	NEt	-(CH ₂) ₄ -

Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	Cl	Me
Ме	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	CF ₈	H
Ме	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	CF ₃	Me
Ме	Me	н	H	1	н	H	NPr-i	OCHF ₂	H
Ме	Me	н	H	1	н	H	NPr-i	OCHF ₂	Me
Ме	Me	н	H	1	н	H	NPr-i		·(CH ₂) ₃ -
Me	Me	н	н	1	н	H	NPr-i		·(CH ₂) ₄ -
Ме	Me	н	H	1	H	H	NPr	Cl	Me
Ме	Me	H	H	1	H	H	NPr	CF ₃	H
Ме	Me	н	H	1	н	Н	NPr	CF ₃	Me
Ме	Me	н	H	1	н	H	NPr	OCHF2	H
Ме	Me	H	H	1	н	H	NPr	OCHF ₂	Me
Ме	Me	н	H	1	H	H	NPr		(CH ₂) ₃ -
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr		(CH ₂) ₄ -
Ме	Me	H	H	1	н	H	NBu-t	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	Н	H	NBu-t	CF ₃	H
Ме	Me	H	H	1	Н	H	NBu-t	CF ₃	Me
Ме	Me	H	H	1	н	H	NBu-t	OCHF2	H
Ме	Me	H	H	1	н	H	NBu-t	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	Н	H	NBu-t	,	(CH ₂) ₃ -
Ме	Me	H	H	1	н	H	NBu-t		(CH ₂) ₄ -
Me	· Me	н	H	1	н	н	NCH ₂ Ph	Cl	Me
Ме	Me	H	H	1	н	H	NCH ₂ Ph	CF ₃	H
Ме	Me	H	H	1	H	н	NCH ₂ Ph	OCHF2	H
Ме	Ме	H	н	1	Н	Н	NCH ₂ OMe	Cl	Me
Ме	Me	Н	Н	1	н	H	NCH2OMe	CF ₃	н
Me	Me	H	H	1	н	Н	NCH ₂ OMe	OCHF ₂	H
Ме	Me	Н	н	1	н	н	NCH ₂ C≡CH	CI	Me
Ме	Me	H	н	1	н	H	NCH₂C≡CH	CF ₃	н
Ме	Me	н	н	1	н	H	NCH₂C≡CH	OCHF2	н
Ме	Me	H	н	1	н	н	NCH ₂ CH=CH ₂	Cl	Me
Me	Me	н	н	1	Н	н	NCH2CH=CH2	CF ₃	н
Ме	Me	Н	н	1	Н	н	NCH2CH=CH2	OCHF2	н
Me	Me	Н	Н	1	H	н	NCHF2	Cı	Me
Me	Me	Н	Н	1	H	н	NCHF2	CF ₃	н
Me	Me	H	Н	1	H	н	NCHF2	CF ₃	Me
Me	Me	H	н	1	H	Н	NCHF2	OCHF2	н
Me	Me	H	Н	1	Н	H	NCHF ₂	OCHF2	Me
1	1	I **	1	1 -	1	1	1	1	1

Me	Ме	H	H	1	н	H	NCHF2	C(=O)Me	н
Me	Me	н	н	1	н	H	NCHF2	C(=O)Me	Me
Me	Me	$_{ m H}$	н	1	н	н	NCHF2	-((CH ₂) ₃ -
Me	Me	H	H	1	н	н	NCHF2	-((CH ₂) ₄ -
Me	Me	н	H	1	н	Н	NPh	OMe	Me
Me	Me	H	H	ī	H	H	NPh	OEt	Me
Me	Me	н	H	1	н	H	NPh	OCHF ₂	Me
Me	Me	н	н	1	н	H	NPh	OCH ₂ CF ₈	Ме
Me	Me	н	н	1	н	Н	NPh	CF ₃	н
Me	Me	$_{ m H}$	н	1	н	н	NPh	OCH ₂ CH=CH	Me
Me	Me	н	н	1	н	н	NPh	² OCH2C≡CH	Me
Me	Me	н	H	1	H	Н	NPh	cı	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(2-Cl)Ph	C1	Me
Me	Me	H	н	1	H	H	N(2-F)Ph	CI	Me
Me	Me	H	H	1	н	H	N(2-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	ī	H	H	N(2-Me)Ph	Cl	Ме
Me	Me	H	H	1	н	H	N(3-Cl)Ph	Cl	Ме
Me	Me	H	H	1	н	H	N(3-F)Ph	Cl	Ме
Me	Me	н	H	1	н	H	N(3-OMe)Ph	C1	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(3-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	н	H	N(4-Cl)Ph	CI	Me
Me	Me	H	н	1	н	H	N(4-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(4-OMe)Ph	cı	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(4-Me)Ph	C1	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(Thiophen-2-yl)	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	н	H	N(Thiophen-2-yl)	CF ₈	н
Me	Me	н	н	1	H	H	N(Thiophen-2-yl)	1	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)Me	C1	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)Me	CF ₃	H
Me	Me	н	H	1	H	H	NC(=O)Me	OCHF ₂	H
Me	Me	н	н	1	н	H	NC(=O)CF3	Cl	Me
Me	Me	H	н	1	H	H	NC(=O)CF3	CF ₈	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)CFs	OCHF2	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)CH ₂ Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)CH ₂ Ph	CF ₃	H
Me	Me	H	н	1	н	H	NC(=O)CH2Ph	OCHF2	H
Me	Me	н	н	1	н	н	NC(=O)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	Н	1	н	н	NC(=O)Ph	CF ₃	н
Me	Me	H	н	1	н	н	NC(=O)Ph	OCHF2	н
Me	Me	H	н	1	н	н	NC(=O)OMe	CI	Me
Me	Me	н	H	1	н	н	NC(=O)OMe	CF ₈	н
Me	1	H	H	1	Н	H	NC(=O)OMe	[н
INTE	I TATE	1 **	1 11	1 -	1	l	1-100	1	1 "

Me	Me	н	H	1	H	H	NC(=0)OCH ₂ Ph	C1	Me
Me	Me	н	н	1	н	н	NC(=0)OCH2Ph	CF ₃	н
Me	Me	н	н	1	н	Н	NC(=0)OCH2Ph	OCHF ₂	н
Ме	Me	н	H	1	н	н	NC(=0)OPh	Cl	Me
Ме	Me	н	H	1	н	H	NC(=O)OPh	CF ₃	H
Ме	Me	н	H	1	н	H	NC(=O)OPh	OCHF2	н
Me	Me	H	н	1	Н	H	NC(=O)NHMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	Н	H	NC(=0)NHMe	CF ₃	H
Ме	Me	H	н	1	н	н	NC(=0)NHMe	OCHF2	H
Me	Me	H	н	1	н	H	NC(=0)N(Me)2	cı	Me
Me	Me	н	н	1	н	н	NC(=0)N(Me) ₂	CF ₃	н
Me	Me	н	н	1	Н	н	NC(=0)N(Me) ₂	OCHF ₂	н
Н	H	н	Н	1	H	H	NPh	Cl	Me
Ме	H	н	Н	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	H	Me	H	1	H	н	NPh	Cl	Me
Ме	Me	н	н	1	Me	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	н	H	1	Et	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	NPh	C1	Me
Me	Me	н	н	1	Ме	Me	NPh	Cl	Me
Me	Et	H	H	1	H	H	NPh	[Cl	Me
Et	Et	H	H	1	H	н	NPh	CI	Me
Me	Pr-i	H	H	1	H	н	NPh	Cl	Me
Me	Pr	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr-c	H	H	1	н	Н	NPh	CI	Me
Me	CH ₂ Pr-c	1	H	1	H	Н	NPh	C1	Me
ſ	(CH ₂) ₂ -	H	H	1	H	H	NPh	CI	Me
-((CH ₂) ₈ -	H	H	1	H	H	NPh	CI ·	Me
-($(CH_2)_4$ -	H	H	1	H	Н	NPh	CI	Me
-((CH ₂) ₅ -	H	H	1	H	н	NPh	Cl	Me
H	-(CH ₂)3-	н	1	н	H	NPh	C1	Me
H	-(CH ₂)4-	н	1	Н	н	NPh	C1	Me
н	-(CH ₂)5-	H	1	н	H	NPh	C1	Ме
H	-(CH ₂)6-	н	1	H	H	NPh	CI	Me
Me	Me	H	H	1	H	Н	0	H	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	0	C1	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	H	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Me
Me	Me	H	н	0	H	H	NMe	C1	H
Ме	Me	H	H	0	H	H	NMe	CI	Me
Me	Me	H	H	0	Н	H	NMe	Cl	Et
Me	Me	H	н	0	н	н	NMe	Cl	CF ₈
Me	Me	н	н	0	H	H	NMe	CF ₃	н
Ме	Ме	Н	н	0	н	н	NMe	CF3	Me

	•								
Me	Me	н	H	0	н	н	NMe	OCHF2	H
Me	Me	H	H	0	н	н	NMe	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	Н	H	NMe	C(=O)Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	C(=O)Me	Me
Ме	Me	H	H	0	H	·H	NMe		-(CH ₂) ₈ -
Ме	Me	H	H	0	H	H	NMe		-(CH ₂) ₄ -
Me	Me	H	H	0	H	Н	NEt	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	Н	NEt	CF ₃	H
Ме	Me	H	H	0	H	H	NEt	CF ₃	Me
Ме	Me	H	H	0	H	H	NEt	OCHF2	H
Ме	Me	H	H	0	Н	н	NEt	OCHF ₂	Me
Ме	Me	H	H	0	H	Н	NEt		-(CH ₂) ₃ -
Me	Me	H	H	0	н	н	NEt		-(CH ₂) ₄ -
Me	Me	H	H	0	н	Н	NPr-i	Cl	Me
Ме	Me	H	H	0	Н	н	NPr-i	CF ₃	н
Ме	Me	н	H	O	н	н	NPr-i	CF ₈	Me
Me	Me	H	H	0	н	н	NPr-i	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	н	Н	NPr-i	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	н	н	NPr-i		-(CH ₂) ₃ -
Me	Me	H	H	0	н	н	NPr•i		-(CH ₂) ₄ -
Me	Me	H	H	0	н	н	NPr	Cl	Me
Ме	Me	H	H	0	н	н	NPr	CF ₃	Н
Me	Me	H	H	0	Н	H	NPr	CF ₃	Me
Ме	Me	H	H	0	н	н	NPr	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	Н	н	NPr	OCHF ₂	Me
Me	Me	н	H	0	H	н	NPr		-(CH ₂) ₃ -
Me	Me	н	H	0	н	н	NPr		-(CH ₂) ₄ -
Me	Me	н	H	0	H	н	NBu-t	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	Н	NBu-t	CF ₃	н
Me	Me	H	H	0	н	н	NBu-t	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	H	н	NBu-t	OCHF ₂	н .
Me	Me	н	H	0	н	н	NBu-t	OCHF ₂	Me
Me	Me	н	H	0	н	н	NBu-t		-(CH ₂) ₃ -
Me	Me	н	H	0	н	н	NBu-t		-(CH ₂) ₄ -
Me	Me	н	н	0	н	н	NCH ₂ Ph	Cl	Me
Me	Me	H	Н	0	н	Н	NCH ₂ Ph	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	Н	H	NCH ₂ Ph	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ OMe	Cl	Me
1 1		1 1					NCH ₂ OMe	- 1	1
Me	Me	H	H	0	Н	Н		CF ₃	H

			_			,	,		1	_
	Me	Me	H	H	0	H	H	NCH₂OMe	OCHF2	H
١	Me	Me	H	H	0	H	H	NCH2C≡CH	Cl	Ме
Ì	Me	Me	н	н	0	н	Н	NCH2C≡CH	CF ₃	H
l	Me	Me	н	H	0	н	H	NCH2C≡CH	OCHF ₂	н
١	Me	Me	H	H	0	н	н	NCH2CH=CH2	Cl	Me
١	Me	Me	н	H	o	н		NCH2CH=CH2	CF3	H
١	i		H	H	0	н	H	NCH ₂ CH=CH ₂	OCHF ₂	H
ļ	Me	Me		H	0	H	H	NCHF2	Cl	Me
١	Ме	Me	H	1		1	H	NCHF2	CF ₈	Н
١	Me	Me	H	H	0	H		i	CFs CFs	Me
١	Me	Me	H	H	0	H		NCHF2		1
l	Me	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	OCHF ₂	H
1	Ме	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	OCHF ₂	Me
1	Ме	Me	н	н	0	H	H	NCHF2	C(=O)Me	H
١	Me	Me	H	н	0	н	H	NCHF2	C(=O)Me	Me
١	Me	Me	H	н	0	н	H	NCHF2	-((CH ₂) ₃ -
1	Me	Me	H	н	0	н	Н	NCHF2	-((CH ₂) ₄ -
	Me	Me	H	Н	0	н	H	NPh	OMe	Me
1	Me	Me	H	H	0	н	H	NPh	OEt	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OCHF2	Me
	Me	Me	н	H	0	H	H	NPh	OCH ₂ CF ₃	Me
	Me	Me	н	н	0	H	H	NPh	CF ₃	H
	Me	Me	H	н	0	H	н	NPh	OCH ₂ CH=CH	Me
	Ме	Me	Н	н	0	н	н	NPh	OCH ₂ C≡CH	Me
	Me	Me	Н	H	0	Н	H	NPh	Cl	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	N(2-Cl)Ph	Cl	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	N(2-F)Ph	Cl	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	N(2-OMe)Ph	Cl	Me
	Me	Me	H	Ĥ	0	H	H	N(2-Me)Ph	Cl	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	N(3-Cl)Ph	Cl	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	N(3-F)Ph	Cl	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	N(3-OMe)Ph	Cl	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	N(3-Me)Ph	Cl	Me
	Me	E .	H	H	0	H	H	N(4-Cl)Ph	Cl	Me Me
	Me	1	H	H	0	H	H	N(4-F)Ph	Cl	Me
	Me		H	1	0	H	H	N(4-OMe)Ph	CI	Me
	Me	I I	H		0	H	H		Cl	Me
	Me	1	H	1	0	H	H		1	
	Me	Me	H	h	0	H	H		ı	H
	Me	1	H		0	H	H	1 .		H
	Me	Me	H	1	0	H	H		C1	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)Me	CF ₃	H
	-									

	Me	Me	н	н	0	H	н	NC(=O)Me	OCHF2	н
	Ме	Me	н	н	0	н	н	NC(=O)CF3	Cl	Me
	Me	Me	н	н	0	H	н	NC(=O)CF3	CF ₃	н
ı	Me	Me	н	н	0	H	H	NC(=O)CF ₃	OCHF ₂	н
	Me	Me	н	н	0	H	н	NC(=O)CH ₂ Ph	Cı	Me
	Ме	Me	H	н	0	H	н	NC(=O)CH ₂ Ph	CF ₃	H
	Me	Me	н	н	0	н	H	NC(=O)CH ₂ Ph	OCHF2	н
	Me	Me	\mid H \mid	Н	Ö	H	н	NC(=O)Ph	Cl	Me
	Ме	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)Ph	CF ₈	н
	Me	Me	H	H	0	H	н	NC(=O)Ph	OCHF ₂	н
1	Ме	Me	н	Н	0	H	H	NC(=O)OMe	Cl	Me
	Me	Me	H	H	0	H	Н	NC(=O)OMe	CF ₃	Н
	Me	Me	н	н	0	н	H	NC(=O)OMe	OCHF ₂	н
-	Ме	Me	H	н	0	H	H	NC(=O)OCH ₂ Ph	Cl	Me
1	Me	Me	н	н	0	H	H	NC(=0)OCH ₂ Ph	CF ₈	H
	Ме	Me	н	н	0	Ħ	H	NC(=0)OCH ₂ Ph	OCHF ₂	н
Ì	Ме	Me	н	H	0	н	H	NC(=O)OPh	Cl	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OPh	CF ₃	H
	Me	Me	н	H	0	H	H	NC(=O)OPh	OCHF ₂	H
	Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=0)NHMe	CI	Me
1	Me	Me	H	H	0	H	Н	NC(=O)NHMe	CF ₃	H
	Me	Me	H	H	0	н	Н	NC(=O)NHMe	OCHF ₂	н
	Ме	Me	H	H	0.	H	H	NC(=O)N(Me) ₂	Cı	Me
	Me	Me	н	H	0	H	H	NC(=0)N(Me) ₂	CF ₃	н
	Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)N(Me) ₂	OCHF ₂	н
	H	H	H	H	0	H	H	NPh	CI	Me
	Me	H	H	H	0	H	H	NPh NPh	C1 C1	Me
	Me Me	Me	Me H	H H	0	Ме	н	NPh	CI	Me Me
	Me	Me	H	H	ő	Et	H	NPh	ci	Me
	Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	NPh	Cl	Me
	Me	Me	H	H	0	Ме		NPh	Cı	Me
	Me	Et	H	H	0	H	,	NPh	CI	Me
	Et	Et	H	H	0	H	H	NPh	CI	Me
	Me Me	Pr-i Pr	H	H H	0	н	H	NPh NPh	C1 C1	Me Me
	Me	Pr-c	H	H	0	H	H	NPh	CI	Me
	Me	CH ₂ Pr-c	H	Н	0	H	Н	NPh	Cl	Me
		(CH ₂) ₂ -	H	н	0	н	H	NPh	Cl	Me
		(CH ₂) ₃ -	Н	H	0	H	Н	NPh	Cl	Me
		(CH ₂) ₄ -	Н	H	0	н	H	NPh	Cı	Me

-((CH ₂) ₅ -	H	н	0	H	н	NPh	CI	Me
Н	-(CH ₂)	3-	н	0	H	Н	NPh	Cl	Me
н	-(CH ₂) ₄ -		H	0	H	Н	NPh	Cl	Me
н	-(CH ₂)	Б-	H.	0	H	Н	NPh	C1	Me
н	-(CH ₂)	6-	H	0	H	Н	NPh	C1	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	0	н	Me
Me	Me	н	Н	0	H	Н	0	C1	Me
Me	Ме	н	H	0	H	H	S	H	Me
Me	Me	н	H	0	H	H	S	C1	Me
Ме	Et	H	H	2	H	H	NH	H	H

表6

	$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$														
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁵	R ³⁵	R ³⁶						
Me	Me	H	H	2	Н	Н	NMe	H	ОМе						
Me	Me	н	H	2	H	l .	NMe	Н	OEt						
Me	Me	H	H	2	H		NMe	H	OCHF ₂						
Me	Me	H	Н	2	H		NMe	H	OCH ₂ CF ₃						
Me	Me	H	H	2	H		NMe		(CH ₂) ₃ .						
Me	Me	Н	H	2	H	1	NMe		(CH ₂) ₄ -						
Me															
Me	Me	H	H	2	H	Н	NEt		(CH ₂) ₄ -						
Me	Me	H	Н	2	Н	Н	NPr-i		(CH ₂) ₃ .						
Me	Me	H	Н	2	H	Н	NPr-i	-4	(CH ₂) ₄ -						
Me	Me	H	H	2	Н	Н	NCHF ₂	-	(CH ₂) ₃ .						
Me	Me	H	Н	2	H	H	NCHF ₂	-((CH ₂) ₄ -						
Me	Me	Н	н	2	Н	Н	N(CH ₂) ₃ () -	H						
Me	Me	H	Н	2	Н	Н	N(CH ₂) ₄ 6	D	н						
Me	Me	H	Н	2	Н	Н	N(CH ₂)	-	Н						
Me	Me	Н	н	2	н	Н	N(CH ₂):	5 	Н						
Me	Me	H	Н	2	Н	Н	NPh	Н	ОМе						
Me	Me	H	н	2	н	н	NPh	H	OEt						
Me	Me	H	Н	2	н	н	NPh	H	OCHF ₂						
Me	Ме	н	н	2	н	н	NPh	Н	OCH₂CF₃						
Me	Me	Н	Н	2	Н	н	0	Ме	Н						
Me	Me	H	H	2	Н	H	S	Me	Н						

							•			
н	Н	н	н	2	н	Н	NPh	j	н	OMe
Me	Н	н	н	2	н		NPh		н	OEt
Me	H	Me	н	2	н	H	NPh		H	ОМе
Me	Me	н	н	2	Me	н	NPh	:	H ·	OEt
Me	Me	H	Н	2	Et	Н	NPh		Н	ОМе
Me	Me	Н	н	2	Pr-i	H	NPh		H	OEt
Me	Me	H	H	2	Me		NPh		H	ОМе
Me	Et	H	Н	2	Н		NPh		H	OEt
Et	Et	H	Н	2	H	1	NPh		H	ОМе
Me	Pr-i	H	H	2	H		NPh		H	OEt
Me	Pr	H	Н	2	H		NPh		H	OMe
Me	Pr-c	H	H	2	H	l	NPh		H	OEt
Me	CH ₂ Pr-c	H	Н	2	H	l	NPh		H .	ОМе
-(0	CH ₂) ₂ -	H	Н	2	H	H	NPh		H	OEt
-(0	CH ₂) ₃ -	Н	Н	2	Н	H	NPh		Н	ОМе
-(0	CH ₂) ₄ -	н	Н	2	Н	н	NPh		н	OEt
-(CH ₂) ₅ -	н	н	2	н	н	NPh		н	ОМе
Н	-(CH ₂)3-	Н	2	н	н	NPh		н	OEt
н	-(CH ₂)4-	н	2	Н	н	NPh		н	ОМе
н	-(CH ₂)5-	н	2	Н	н	NPh		н	ОМе
н	-(CH ₂)6-	н	2	н	Н	NPh		H	OEt
Me	Me	H	н	1	н	Н	NMe		н .	ОМе
Me	Me	H	Н	1	H	2	NMe		H	OEt
Me	Me	H	H	1	H		NMe		H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	i	NMe		H	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	·	-	(CH ₂) ₃ .
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe			(CH ₂) ₄ -
Me	Me	H	Н	1	Н	H	NEt			(CH ₂) ₃ .
Me	Me	H	Н	1	H	H	NEt		7	(CH ₂) ₄ -
Me	Me	H	H	1	Н	Н	NPr-i		· -	(CH ₂) ₃ .
Me	Me	Н	H	1	Н	н	NPr-i		4	(CH ₂) ₄ -
Me	Me	H	н	1	Н	Н	NCHF ₂			(CH ₂) ₃₋
Ме	Me	H	н	1	Н	H	NCHF ₂	i		(CH ₂) ₄ -
Me	Me	н	Н	1	Н	H		N(CH ₂) ₃ C)-	H
Me	Me	Н	Н	1	H	H		N(CH ₂) ₄ C) <u> </u>	h
Me	Me	H	H	1	H	H	1	N(CH ₂) ₄ -	•	H
Ме	Me	Н	н	1	H	Н		N(CH ₂) ₅ -	•	н
Me	Me	H	Н	1	H	Н	NPh		н	OMe
Me	Me	H	Н	1	H	Н	NPh		н	OEt
Me	Me	H	Н	1	н	H	NPh		H	OCHF ₂
Me	Me	н	н	1	Н	Н	NPh		н	OCH₂CF₃
•	•	•	•	-	•	•	•			•

1 3/2	1 24-	1	1	. 1 .	1	,	1-				
Me	Me	H					0		Me		H
Me H	Me	H				H	1		Me		Н
Me	H	H	1		H	H	i i		H		ОМе
Me	H	Me	ı	1	H	H			H		OEt
Me	Me	H	1	1	H Me		NPh NPh		H		OMe
Me	Me	H		1	Et		NPh		H	1	OEt
Me	Me	H	1	1	Pr-i	1	NPh		H H		OMe
Me	Me	H	H			1	NPh		H	1	OEt OMe
Me	Et	H	Н	1	Н		NPh		H		Oivie OEt
Et	Et	H	Н	1	Н	Н	1		н	1	OMe
Me	Pr-i	H	H	1	Н	н	NPh		Н		OEt .
Me	Pr	H	Н	1	Н	Н	NPh		Н		ОМе
Me	Pr-c	H	Н	1	H	Н	NPh		Н	- 1	DEt
Me	CH ₂ Pr-c	H	Н	1	Н	н	NPh		Н	- 1	ОМе
-(CH ₂) ₂ - H		н	н	1	H	н	NPh		н	1	DEt .
-(CH ₂) ₃ - H		H	Н	1	н	Н	NPh		Н	- 1	OMe
-(CH ₂) ₄ - H		н	1	Н		NPh		н	- 1	DEt .	
1	-(CH ₂) ₅ - H		Н	1	Н		NPh		1	- 1	
	H -(CH ₂) ₃ -		Н	1	1 1				H	- 1)Me
1					H		NPh		H	- 1)Et
H	' = '		Н	1	H		NPh		H	C)Me
H			Н	1	H		NPh		H	c)Me
Н	<u> </u>		H	1	H		NPh		H	c)Et
Me	Me	H	Н	0	H		NMe		н	c	Ме
Me	Me	H	H	0	H		NMe		н	0	Et
Me Me	Me	H	H	0	H		NMe		н		CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H		NMe		H		CH₂CF₃
j	Me	H	H	0	H		NMe		-(CH ₂) ₃₋		
Me	Me	H	H	0	H	- 1	NMe		-(CH ₂) ₄ -		
Ме	Ме	H	H	0	H	F	NEt		-(CH₂)₃.		
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt		-(CH ₂) ₄ -		
Me	Me	Н	Н	0	H	н	NPr-i		-(CH ₂) ₃₋		
Me	Me	H	H	0	H	н	NPr-i		-(CH ₂) ₄ -		
Me	Me	H	H	0	н	H	NCHF ₂		-(CH ₂) ₃₋		
Ме	Me	Н	н	0	н	н	NCHF ₂		-(CH ₂) ₄ -		
Ме	Ме	н	н	0	н	н		N(CH ₂) ₃ O			
Me	Me	н	н	0	н	н		N(CH ₂) ₄ O	l l		
Me	Ме	H	н	0	i	н		N(CH ₂) ₄ -			
Me	Me	н	н	0		н		N(CH ₂) ₅ -	H		1
Ме	Me	- 1	н	0		ļ.	NPh		H OMe		Me
Me	Me	- 1	H	0		H			H .	OF	
'	ı	- 1	ı	1	1	1-	-	ŀ		lor	n

	1	1 1					1	ı	1 .
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	н	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	н	H	NPh	H	OCH₂CF₃
Me	Me	H	н	0	н	H	o	Ме	H
Me	Me	H	Н	0	н	H	S	Ме	н
H	H	н	н	0	H	H	NPh	H	OMe
Me	H	н	н	0	H	H	NPh	н	OEt
Me	H	Me	Н	0	H	i	NPh	H	ОМе
Me	Me	H	H	0	Me	H	NPh	H	OEt
Me	Me	н	H	0	Et		NPh	H	OMe
Me	Me	H	Н	0	Pr-i	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	0	Me		NPh	Н	ОМе
Me	Et	Н	Н	0	H		NPh	H	OEt
Et	Et	H	н	0	H	1	NPh	H ·	OMe
Me	Pr-i	H	Н	0	H		NPh	H	OEt
Me	Pr	H	H	0	н	ı	NPh	H	OMe
Me	Pr-c	H	H	0	H	н	NPh	н	OEt
Me	CH ₂ Pr-c	н	Н	0	Н	Н	NPh	н	OMe
-(0	CH ₂) ₂ -	н	н	0	H	н	NPh	н	OEt
-(0	CH ₂) ₃ -	н	Н	0	н	Н	NPh	H	OMe
-(0	CH ₂) ₄ -	н	н	0	Н	Н	NPh	H	OEt
-(0	CH ₂) ₅ -	н	н	0	Н	н	NPh	н	ОМе
Н	-(CH ₂)3-	н	0	Н	H	NPh	н	OEt
н	-(CH ₂)4-	н	0	H	н	NPh	н	ОМе
н	-(CH ₂)5-	Н	0	H	н	NPh	H	ОМе
н	-(CH ₂)6-	н	0	Н	н	NPh	H	OEt
Me	Et	Н	н	2	Н	H	0	н	н
Ме	Et	H	Н	2	H	Н	s	н	H
Me	Et	н	Н	2	Н	H	NH	H	H

表 7

					R ¹ —	R ³	R ⁴ R ³⁸ F	2 39						
				_	ر <u>—</u>)							
					Ŭ	'n	$S(O)_{\overline{n}}C$	R ⁴⁰						
							$ \begin{array}{c c} R^5 & \longrightarrow N \\ R^{87} & \longrightarrow N \end{array} $							
701	To	Tan	177.	т	T==	150	, 	O)	т	γ	r			
R1	R ²	R ³	R4	n	R ⁵	R ₆	R ³⁷	R38	Rss	1				
Me Me	Me Me	H	H	2	H	H	H	H	H	H	-			
Me	Me	H	H	2 2	H	H	H Cl	H	H	H	N-oxide			
Me	Me	H	H	2	H	HH	OMe	Ph Ph	H	H				
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	H	H				
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	H	H	.			
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	.			
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	N-oxide			
Me	Me H H 2 H H Cl CF ₃ H H - Me H H 2 H H CN CF ₃ H H -													
Me	Me H H 2 H H CN CF3 H H - Me Me H H 2 H H OMe CF3 H H -													
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CF ₃	H	H				
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt ·	CF ₃	H	н	-			
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	H.	H	N-oxide			
Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Ph	H	H	•			
Me Me	Me Me	H	H	2 2	H	H	Cl Cl	(4-Cl)Ph	H	Ме	-			
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	(4-Cl)Ph Cl	H	H				
Me	Me	H	Н	2	H	H	Cl	(CH ₂):		H				
Me	Me	н	H	2	н	н	Me	(CH ₂):		H				
Ме	Me	н	H	2	н	н	Cl	(CH ₂),		H	. [
Me	Me	н	H	2	H	н	Me	(CH ₂)		н	-			
Me	Me	Н	H	2	Н	H	Cl	H	(CI	I ₂) ₈	-			
Ме	Me	H	H	2	H	H	Me	H	(CI	I2)3	-			
Ме	Me	H	H	2	H	H	Cl	H	(CE	[2)4	-			
Ме	Me	H	H	2	H	H	Me	н	(CE	[2)4	-			
H	H	H	H	2	н	H	H	$\mathbf{CF_8}$	H	H	-			
Me	H	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-			
Me	H	Me	: I	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-			
Me	Me	Me	H	2	H	H	H	CF₃	H	H	-			
Me	Me	н	H	2	Ме	H	H	CF ₈	H	H	-			
Me	Me	H	H	2	Et	H	H	CF ₃	H	H	-			

					_	_					
Me	Me	H	H	2	Pr-i	н	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	2	Me	Me	H	CF ₃	H	H	-
Me	Et	H	H	2	н	H	H	CF ₃	H	H	-
Et	Et	H	H	2	H	H	H .	CF ₈	H	H	-
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	H	CF ₈	H	H	-
Me	\mathbf{Pr}	н	H	2	H	H	H	CF ₈	H	H	-
Me	Pr-c	H	H	2	н	H	H	CF ₃	H	H	-
Ме	CH ₂ Pr- c	н	н	2	H	н	H	CF ₃	H	H	-
-	$(CH_2)_2$ -	H	H	2	H	Н	H	CF ₈	H	H	-
	(CH ₂) ₃ -	H	H	2	н	H	H	CFs	H	H	.
	(CH ₂) ₄ -	H	H	2	н	Н	H	CF ₃	H	H	
- ((CH ₂) ₅ -	H	\mathbf{H}	2	н	H	H	CF ₈	H	H	-
H	-(CH ₂)3-	н	2	н	н	н	CF ₈	H	Н	-
H	-(CH ₂)4-	H	2	н	H	H	CF ₃	H	н	.
H	-(CH ₂) ₅ -	H	2	н	н	H	CF ₃	н	H	
H	-(CH ₂) ₆ -	H	2	н	H	H	CF ₃	н	H	-
Me	Me	H	н	1	н	H	H	н	H	H	
Me	Me	H	H	1	H	H	H	H	H	H	N-oxide
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Ph	H	H	-
Me Me	Me Me	H	H	1	H	H	OMe	Ph	H	H	·
Me	Me	Н	H	1	H	H	Cl OMe	Me Me	H	H	1]
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CF ₃	н	H	
Me	Me	н	H	1	H	H	Cl	CF ₃	H	H	.
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	CF ₃	Н	H	.
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	CF ₃	H	H	_
Me	Me	H	н	1	H	H	OEt	CF ₃	Н	H	_
Ме	Me	H	H	1	H	H	Me	Me	H	H	N-oxide
Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Ph	Ħ	H	·
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	Me	
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	Cl	H	H	-
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$(CH_2)_{3}$	3	H	-
Me	Me	H	H	1	H	н	Me	(CH_2)	3	H	-]
Me	Me	H	н	1	H	H	Cl	$(CH_2)_4$		H	-
Me	Me	H	н	1	H	H	Me	(CH ₂) ₄	· i	H	-
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	H	(CI	$I_2)_8$	-
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	н	(CE	I2)8	-
Ме	Me	н	H	1	н	H	Cl	н	(CE	I2)4	-

								•			
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	H	(C	$H_2)_4$	
H	н	H	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H] •
Me	H	H	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H	- ,
Me	H	Ме	H	1	H	H	H.	CF ₈	H	H	
Me	Me	Me	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H	- 1
Me	Me	H	H	1	Ме	H	H	CF ₈	H	H	-
Me	Me	H	H	1	Et	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	1	Pr-i	Н	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	1	Me	Me	H	CF ₃	H	H	- 1
Me	Et	H	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Et	Et	H	H	1	H	Н	H	CF ₃	H	H	
Me	Pr-i	H	н	1	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Pr	н	н	1	H	н	H	CF ₈	H	H	-
Me	Pr-c	н	н	1	H	Н	H	CF ₃	H	H	-
Ме	CH ₂ Pr-	H	н	1	н	н	н	CF ₃	н	н	.
-	(CH ₂) ₂ -	н	Н	1	н	н	H	CFs	H	H	
	(CH ₂) ₃ -	н	н	1	H	н	H	CF ₃	н	H	-
-	(CH ₂) ₄ -	н	н	1	H	H	н	CF ₃	H	H	.
	(CH ₂) ₅ -	H	н	1	н	н	H	CFs	H	н	-
H	-(CH ₂) ₃ -	н	1	н	H	H	CFs	H	H	
H	-(CH ₂)4-	H	1	н	H	H	CF ₃	H	н	.
H	-(CH ₂) ₅ -	H	1	н	н	H	CF ₈	H	н	-
H	-(CH ₂) ₆ -	H	1	H	H	H	CF ₃	н	н	- 1
Me	Me	H	H	0	H	H	. H	н	H	н	-
Me	Me	H	H	0	H	H	H	H	H	H	N-oxide
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Ph	H	H	-
Me Me	Me Me	H	H	0	H	H	OMe	Ph	H	H	-
Me	Me	Н	Н	0	H H	H	Cl OMe	Me Me	H	H	
Me	Me	H	Н	0	H	H	H	CF ₃	Н	H	
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CF ₃	H	H	
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	CF ₃	H	H	. 1
Me	Me	H	н	0	H	H	OMe	CF ₈	H	H	
Ме	Me	H	H	0	H	H	OEt	CF ₈	H	H	
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Me	H	H	N-oxide
Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Ph	H	H	TA OVIGE
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	Me	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	C1	H	H	-

		_	_								
Me	Me	Н	H	0	н	H	CI	(CH ₂)3	H	
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	(CH ₂) ₈	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	C1	(CH ₂)4	H] -
Me	Me	H	H	0	н	H	Me	(CH ₂	4	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	H	(C	H ₂) ₃	
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	H	(C)	$H_2)_3$	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	H	(C)	$H_2)_4$	
Me	Me	H	H	0	H	н	Me	H	(C)	$H_2)_4$	-
Ме	Ме	н	н	0	н	н	(2-Chloropyridin-3- yl)methylthio	H	H	н	<u>:</u>
H	H	н	H	0	H	H	H	$\mathbf{CF_3}$	H	н	-
Me	H	H	H	0	н	H	H	CF ₈	H	H	
Me	Me	Me	H	0	H	H	H	$\mathbf{CF_3}$	H	H	-
Me	H	Me	H	0	H	H	H	$\mathbf{CF_8}$	H	н] -
Me	Me	H	H	0	Me	H	H	$\mathbf{CF_8}$	н	н	-
Me	Me	H	H	0	Et	H	H	CF ₃	H	н	-
Ме	Me	H	H	0	Pr-i	н	Ħ	CF3	H	H	-
Me	Me	H	H	0	Me	Ме	H	$\mathbf{CF_8}$	H	н	- .
Me	Et	H	H	0	н	H	н	CF_3	H	H	-
Et	Et	н	H	0	H	H	H	$\mathbf{CF_8}$	H	H	-
Ме	Pr-i	H	H	0	H	H	H	$\mathbf{CF_3}$	H	H	-
Ме	\mathbf{Pr}	H	H	0	н	H	H	$\mathbf{CF_3}$	H	H	-
Ме	Pr-c	н	H	0	H	H	H	$\mathbf{CF_8}$	H	H	-
Ме	CH ₂ Pr-	н	н	0	н	н	н	$\mathbf{CF_8}$	H	н	-
-($(CH_2)_2$ -	H	H	0	H	H	H	$\mathbf{CF_8}$	H	н	-
-($(CH_2)_3$ -	H	H	0	H	H	H	$\mathbf{CF_3}$	н	H	-
-((CH ₂) ₄ -	н	H	0	H	H	H	$\mathbf{CF_{s}}$	н	H	-
((CH ₂) ₅ -	H	H	0	H	H	H	$\mathbf{CF_s}$	H	H	-
H	-(CH ₂)8-	H	0	H	H	H	$\mathbf{CF_8}$	H	H	-
H	-(CH ₂)4-	H	0	H	H	H	$\mathbf{CF_{8}}$	H	H	-
H	-(CH ₂)5-	H	0	н	н	H	$\mathbf{CF_3}$	H	H	-
H	-(CH ₂)6-	H	0	Η	H	H	$\mathbf{CF_3}$	H	H	- '
Me	Et	Η	H	2	H	H	H	<u>H</u>	H	H	-

WO 02/062770 PCT/JP02/01015

表8

									
			$R^1 \xrightarrow{R^2}$	R ⁸ R	4		R ⁴⁸		
			$\mathbb{R}^1 \longrightarrow$	- Y		Ŗ ⁶			
			Ò,	$\sqrt{}$	`S(O)		<u> </u>	$ m R^{41}$	
					- 1 п	-b5	<u></u>		
<u> </u>				,		1	42		
R ¹	\mathbb{R}^2	R ³	R4	n	\mathbb{R}^5	\mathbb{R}^6	R ⁴¹	R42	R43
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	Cl
Ме	Me	H	H	2	H	H	H	OH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	ОМе	Cl
Me	\mathbf{Me}	H	H	2	H	H	H	OEt	Cl
Me	Me	H	H	2	Ή	H	H	OPr-i	C1
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu·c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex·c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	C1
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	Cl
Me	Me	Н	H	2	H	H	H	OCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Et	Cl
Me	Me	H	H	2	. H	H	H	SPr·i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH_2	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	${ m NEt_2}$	Cl
Me	${f Me}$	H	H	2	H	H	H	NHPh	Cl
Me	${f Me}$	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	Cl

Ме	Me	н	Н	2	н	H	н	l F	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cı	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	Me
Me	Me	H	H	.2	H	H	H	OMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Et	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr·i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	\mathbf{H}	SO_2Ph	Me
Me	Me	H	H	2	Н	H	H	SCHF ₂	Me
Me	Me	H	Η	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$\mathrm{NH_2}$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe_2	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt_2	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	\mathbf{H}	F	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	Pr-i
Me	Me	Н	H	2	H	H	\mathbf{H}	OMe	Pr-i
Me	Me	H	H	2	Н	н	H	OEt	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr·i	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	Pr-i
Me	Me	Н	Н	2	н	H	${f H}$	OBu-t	Pr·i

Me	Me	H	Н	2	H	H	H	OCH ₂ Pr·c	Pr-i
Ме	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Pr-i
Ме	Me	H	Н	2	H	H	H	OCH ₂ Pen·c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	Н	H	H	OCH ₂ Hex-c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen·c	Pr-i
Me	Me	н	H	2	H	H	H	OHex-c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	2	Η	H	H	OPh	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	Pr-i
Ме	Me	H	H	2	H	H	H	SH	Pr-i
Me	Me	Η	H	2	H	H	H	SMe	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	\mathbf{H}	SO ₂ Me	Pr·i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Et	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr i	Pr-i
Ме	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	Pr-i
Ме	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Ph	Pr·i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	$ \mathbf{H} $	H	SO ₂ CHF ₂	Pr·i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH_2	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	Pr•i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe_2	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt_2	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	Pr·c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	Pro
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	Pr·c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Pr·c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex·c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	Pr-c

Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	Pr-c
Ме	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Me	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Et	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	Pr·c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Pr·c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	Ή	SO ₂ Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	Pr·c
Me	Me	H	H	2	H	H	\mathbf{H}	SO ₂ CHF ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH_2	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	\mathbf{H}	NMe ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	$\mid \mathbf{H} \mid$	H	OCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO₂Et	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	CHF ₂

Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$ m NH_2$	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe_2	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	CHF ₂
Me	Me	H	Η	2	H	H	H	NEt ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Η	H	H	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	\mathbf{H}	ОМе	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	\mathbf{H}	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	\mathbf{H}	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr·c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$ m NH_2$	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe ₂	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	CF ₃

Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me M	нинининининин	нннннннннннн	2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2	нинининини	H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	H H H H H H H H H H	NEt ₂ NHPh N(Me)Ph CN F OH OMe OEt OPr-i OPr OBu-t OCH ₂ Pr-c	CF ₃ CF ₃ CF ₃ OMe OMe OMe OMe OMe OMe OMe
Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me M	нинининининин	нннннннннн	2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2	H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	H H H H H H H H H H H	H H H H H H	N(Me)Ph CN F OH OMe OEt OPr-i OPr OBu-t	CF ₃ CF ₃ OMe OMe OMe OMe OMe OMe OMe
Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me M	нининининин	ннннннннн	2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2	H H H H H H H H H H H H H H	H H H H H H H	H H H H H H	CN F OH OMe OEt OPr OPr OBu-t	CF ₃ OMe OMe OMe OMe OMe OMe OMe
Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me M	нининининин	н н н н н н н н н н н н н н н	2 2 2 2 2 2 2 2 2 2	H H H H H H H H H H H	H H H H H H	H H H H H	F OH OMe OEt OPr-i OPr OBu-t	OMe OMe OMe OMe OMe OMe OMe
Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me M	нининининин	нн н н н н н н н н н н н н н н н н н н	2 2 2 2 2 2 2 2	H H H H H H H H H H H	H H H H H H	H H H H H	OH OMe OEt OPr-i OPr OBu-t	OMe OMe OMe OMe OMe OMe
Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me M	H H H H H H H H H H H H H H	нинининин	2 2 2 2 2 2 2 2	H H H H H	H H H H H	H H H H	OMe OEt OPr-i OPr OBu-t	OMe OMe OMe OMe OMe
Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me M	H H H H H H H H H H H H	нининин	2 2 2 2 2 2 2	H H H H	H H H H	H H H H	OEt OPr-i OPr OBu-t	OMe OMe OMe OMe
Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me M	H H H H H H H	H H H H H H H	2 2 2 2 2 2	H H H H	H H H H	H H H	OPr-i OPr OBu-t	OMe OMe OMe
Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me	H H H H H H	H H H H H	2 2 2 2	H H H	H H H	H H	OPr OBu-t	OMe OMe
Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me	H H H H H	H H H H	2 2 2 2	H H H	H H	H	OBu-t	ОМе
Me Me Me Me Me Me Me Me	H H H H	H H H H	2 2 2	H	н			
Me Me Me Me Me Me	H H H H	H H H	2 2	H	1 1			OMe
Me Me Me Me	H H H	H H	2		H	H	OCH ₂ Bu-c	OMe
Me Me	H H H	н		\mathbf{H}	H	H	OCH ₂ Pen-c	OMe
	H		2	H	H	Ĥ	OCH ₂ Hex-c	OMe
	H		2	H	H	H	OPen-c	OMe
Me Me		H	2	H	H	H	OHex-c	OMe
Me Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	OMe
Me Me		H	2	H	H	H	OPh	OMe
Me Me		H	2	H	H	H	OCHF ₂	OMe
Me Me	1	Н	2	H	H	H	SH	OMe
Me Me	t t	H	2	H	H	H	SMe	ОМе
Me Me		H	2	H	Н	H	SO_2Me	OMe
Me Me	4	H	2	H	H	\mathbf{H}	SEt	OMe
Me Me		H	2	H	H	\mathbf{H}	SO ₂ Et	ОМе
Me Me		H	2	H	$ \mathbf{H} $	H	SPr-i	OMe
Me Me		H	2	H	H	\mathbf{H}	SO ₂ Pr-i	OMe
Me Me		H	2	H	H	\mathbf{H}	SPh	OMe
Me Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Ph	OMe
Me Me	\mathbf{H}	H	2	H	H	H	SCHF ₂	OMe
Me Me	H	H	2	H	H	\mathbf{H}	SO ₂ CHF ₂	OMe
Me Me	\mathbf{H}	H	2	H	H	H	NH ₂	OMe
Me Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	OMe
Me Me	\mathbf{H}	H	2	H	H	H	NMe ₂	OMe
Me Me	\mathbf{H}	H	2	H	H	H	NHEt	OMe
Me Me		H	2	H	H	\mathbf{H}	NEt ₂	OMe
Me Me		H	2	H	H	H	NHPh	OMe
Me Me		H	2	H	H	H	N(Me)Ph	OMe
Me Me		H	2	Н	H	H	CN	OMe
Me Me		H	2	H	H	H	F	OPh
Me Me	,	H	2	H	$ \mathbf{H} $	H	OH	OPh
Me Me	1	H	2	H	H	H	OMe	OPh
Me Me		H	2	H	H	H	OEt	OPh
Me Me	1	H	2	H	H	H	OPr-i	OPh

WO 02/062770

ar-	Me	н	н l	2	н	H	н	OPr	OPh
Me		H	H	2	H	H	H	OBu-t	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen·c	OPh
Me	Me	H	Н	2	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	OPh
Me	Me Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	OPh
Me Me	Me Me	H	H	2	H	H	H	OPh	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Et	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPri	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Ph	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH ₂	OPh
Me	Me	H	H	2	Н	н	H	NHMe	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe ₂	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt ₂	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	OPh
Me	Me	H	Н	2	H	H	H	F	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OCHF2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	Н	OHex-c	OCHF ₂
1	1		H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	$ OCHF_2 $
Me	Me	H			H	H	H	OCH ₂ Ph	OCHF ₂

Me	Me	H	H	2	H	$H \mid$	H	OPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	н	SMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$\mathrm{SO}_2\mathrm{Et}$	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	н	H	H	SO ₂ Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2CHF_2	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	н	NH_2	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe_2	OCHF ₂
Me	Me	H	Н	2	H	H	H	\mathbf{NHEt}	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	\mathbf{H}	H	H	$\mathbf{NEt_2}$	OCHF ₂
Me	Me	H	Н	2	H	H	H	NHPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	\mathbf{F}	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	$ \mathbf{H} $	Me	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH ₂ Pen·c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OPen-c	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SH	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SEt	CF ₃
Me		H	H	2	H	H	Me	SO ₂ Et	CF ₃
Me		H	H	2	H	H	Me	SPr-i	CF ₃

اعما	30 E	тт і	TT	2	н	H	Me	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	$\frac{2}{2}$	H	H	Me	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NH ₂	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NHMe	CF ₈
Me	Me	Н	H	2	H	H	Me	NMe ₂	CF ₈
Me	Me	Н	H	2	H	H	Me	NHEt	CF ₃
Me	Me		H	2	H	H	Me	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NHPh	CF ₃
Me	Me	Н	H	2	H	H	Me	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me Me	H	H	2	H	H	Me	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	F	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	C1	$\mathbf{CF_3}$
Me Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OPr	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	Н	OMe	OCH ₂ Pr·c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	н	H	ОМе	OCH ₂ Bu-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OCH ₂ Pen·c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OCH ₂ Hex-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OPen-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OHex-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	ОМе	OCH ₂ Ph	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OCHF ₂	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	Ή	OMe	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	L.	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	ı	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	t .	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NMe ₂	CF ₃

								•	
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NEt_2	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	\mathbf{F}	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Н	H	SMe	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OEt	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	\mathbf{OPr}	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Н	н	SMe	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCH ₂ Pen·c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	$ \mathbf{H} $	SMe	OCH_2Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	$OCHF_2$	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SO_2Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	$ m SO_2Et$	CF ₃
Me	Me	H	н	2	H	H	SMe	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SPh	CF_3
Me	Me	H	н	2	H	H	SMe	SO_2Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	NH ₂	$\mathbf{CF_8}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	NHMe	CF ₃
Me		H	H	2	H	H	SMe	NMe_2	CF ₃
Me		H	H	2	H	H	SMe	NHEt	CF ₃
Me	1	H	H	2	H	H	SMe	NEt_2	CF ₃
Me		H	H	2	H	H	SMe	NHPh	CF_3
Me	1	H	H	2	H	H	SMe	N(Me)Ph	CF ₃
Me		H	H	2	H	H	SMe	CN	CF ₃
Me	1	H	H	2	H	H	SO ₂ Me		CF ₃
Me	1	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	I	CF ₈
Me	E .	H	H	2	H	H		1	CF ₃

Me l	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OEt	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	\mathbf{H}	H	SO ₂ Me	OPr-i	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OPr	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OCH ₂ Pr-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Pen-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	\mathbf{H}	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Hex-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	Η	2	\mathbf{H}	H	SO ₂ Me	OPen-c	$\mathbf{CF_3}$
Ме	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OHex-c	$\mathbf{CF_3}$
Ме	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OCH_2Ph	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OPh	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SH	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SO_2Me	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SEt	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	$\mathrm{SO}_2\mathrm{Et}$	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SPr-i	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SO_2Pr-i	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SPh	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	$\mathrm{SO}_2\mathrm{Ph}$	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SCHF ₂	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ CHF ₂	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	NH_2	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	F	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OEt	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OCH ₂ Pr·c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OCH ₂ Pen·c	CF_3

Me l	Me	нΙ	н	2	н	Ηİ	NH ₂	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	$\bar{2}$	H	H	NH_2	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OCH_2Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OPh	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OCHF ₂	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SH	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SO ₂ Me	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	$\mathrm{SO}_2\mathrm{Et}$	$\mathbf{CF_8}$
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SPr-i	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	ÌΗ l	H	2	Η	H	NH_2	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	$ \mathbf{H} $	NH_2	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	\mathbf{H}	2	H	H	NH_2	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	CN	CF ₃
H	H	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₈
H	H	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	H	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	H	Me	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	. H	2	Me	H	H	OMe OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Et	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Et	H	H	H	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Pri		H		CF ₃
Me	1	H	H	2	Pr-i	1	H	OEt	CF ₃
Me		H	H	2	Me	Me	l .	OMe	CF ₃
Me	1	H	H	2	Me	Me		OEt	CF ₃
Me		H	H	2	H	H	H	OMe	
Me	1	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Et	Et	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Et	Et	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃

WO 02/062770

							1	1	1
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Pr•i	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	\Pr	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	\mathbf{Pr}	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
-((CH ₂) ₂ -	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
-($(CH_2)_2$ -	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
-($(\mathrm{CH_2})_3$ -	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
-($(CH_2)_3$ -	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
	$(CH_2)_4$ -	H	H	2	H	\mid H \mid	H	OMe	CF ₃
	$(CH_2)_4$	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
	$(CH_2)_5$ -	H	Η	2	H	H	H	OMe	CF_3
	$(CH_2)_5$	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CH	2)3-	Н	2	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CH		H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
H	(CH		Η	2	H	H	H	OMe	CF ₃
H	·(CH	2)4-	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CH	2)5-	H	2	H	H	\mathbf{H}	OMe	CF ₃
H	-(CH	2)5-	H	2	H	H	H	\mathbf{OEt}	CF ₃
H	-(CH	2)6-	H	2	H	H	H	ОМе	$\mathbf{CF_3}$
H	-(CH	2)6-	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	C1
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	Cl
Me		H	H	1	H	H	H	OHex-c	Cl
Me	I	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	Cl
Me	,	H	H	1	H	H	H	OPh	CI
Me		H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	Cl
Me	1	H	H	1	H	H	H	SH	Cl
Me	1	H	H	1	H	H	H	SMe	Cl
Me		H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	Cl
Me		H	H	1	H	Н	1	SEt	Cl

3e	36 1	TT 1	77 l	- I	нΙ	нΙ	н	SO ₂ Et	Ci
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	Cl
Me	Me Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	CI
Me		H	H	i	H	#	H	CN	Cl
Me	Me Me	H	H	1	H	$ \stackrel{\dots}{_{\mathbf{H}}} $	H	F	Me
Me Me	Me Me	H	H	i	H	H	H	Ĉ1	Me
Me	Me	H	H	i	H	H	H	OH	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	Me
Me	Me	H	н	1	H	H	H	OEt	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	OPr	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Me
Me	Me	H	H	1	н	H	H	OCH ₂ Bu-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Ph	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH ₂	Me

WO 02/062770

Me Me H H I H H H H NHMe Me Me Me H H I H H H H NHMe Me Me Me Me H H I H H H H NHMe Me Me Me H H I H H H H NHMe Me Me Me H H I H H H H NHPh Me Me Me H H I H H H NHPh Me Me Me H											
Me Me H H I H	1	Me I	Me l	н	H	1	н	H	н	NHMe	Me
Me Me H H I H H H NHEL Me Me Me H H I H H H H NEL Me Me Me H H I H H H H NEL Me Me Me H H I H H H H NHEL Me Me Me H H I H H H NHEL Me Me Me H H I H H H H NCMe)Ph Me Me Me Me H H I H H H H CN Me Me Me H H I H H H GI Pri Me Me Me H H I H H H OH Pri Me Me Me H H I H H H OOH Pri Me Me Me H H I H H H OOPri Me Me Me H H I H H H OOPri Me Me Me H H I H H H OOPri Me Me Me H H I H H H OOPri Me Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H OOH Me Me H H I H H H SOL Me Me H H I H H H SOL Me Me H H I H H H SOL Me Me H H I H H H SOL Me Me H H I H H H SOL Me Me H H I H H H SOL Me Me H H I H H H SOL Me Me H H I H H H SOL Me Me H H I H H H SOL Me Me H H I H H H SOL Me Me H H I H H H SOL Me Me H H I H H H SOL Me Me H H I H H H H H SOL Me Me H H I H H H H H SOL Me Me H H I H H H H H SOL Me Me H H I H H H H H SOL Me Me H H I H H H H H SOL Me Me H H I H H H H H H SOL Me Me H H I H H H H H H SOL Me Me H H I H H H H H H SOL Me Me H H I H H H H H H SOL Me Me H H I H H H H H H H SOL Me Me H H I H H H H H H H H SOL Me Me H H H I H H H H H H SOL Me Me H H I H H H H H H H H SOL Me Me H H H I H H H H H H H H SOL Me Me H H I H H H H H H H H H SOL Me Me H H H I H H H H H H H H H SOL Me Me H H H I H H					1					NMe ₂	Me
Me Me H H 1 H H H NEtz Me Me Me H H 1 H H H H N(Me)Ph Me Me Me H H 1 H H H H N(Me)Ph Me Me Me H H 1 H H H H CN Me Me Me H H 1 H H H H CN Me Me Me H H 1 H H H H CI Pri Me Me Me H H 1 H H H OH Pri Me Me Me H H 1 H H H OOH Pri Me Me Me H H 1 H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H H OOT Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H SOAPH Pri Me Me Me H H 1 H H H H NHME Pri	l				1				1	· ·	Me
Me Me H	l	4	1		1			1		NEt ₂	Me
Me Me H H I H	l					,				- 1	
Me Me H H I H	١		1							3	Me
Me Me H H I H	١			1		_					
Me Me H H I H	١										Pr•i
Me Me H H I H	١				1			i 1	- 1		Pri
Me Me H H I H	١									OH	Pr-i
Me Me H H I H	l		1							OMe	
Me Me H H I H	I										Pri
Me Me H H I H	١							l 1			Pr-i
Me Me H H 1 H	١				,			. I	н	OPr	Pr-i
Me Me H H 1 H	ĺ			1					H	OBu-t	Pri
Me Me H H 1 H	١							H	H	OCH ₂ Pr-c	Pr-i
Me Me H H 1 H	ł									OCH ₂ Bu-c	Pr-i
Me Me H H 1 H	l					1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Pr-i
Me Me H H 1 H	۱					1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Pr-i
Me Me H H 1 H	١				H	1	H	H	H	OPen-c	Pri
Me Me H H 1 H	١				Н	1	H	H	H	OHex-c	Pr-i
Me Me H H 1 H	I			H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	1
Me Me H H 1 H	١			H	H	1	H	H	H		
Me Me H H 1 H	l		Me	H	H	1	H	$ \mathbf{H} $	H	_	1
Me Me H H 1 H	Ì	Me	Me	H	H	1	H	$ \mathbf{H} $		1	
Me Me H H 1 H	Ì	Me	Me	H	H	1	H	H		SMe	
Me Me H H 1 H	i	Me	Me	H	H	1	H	H			
Me Me H H 1 H	ı	Me	Me	H	H	1	H	H	H		
Me Me H		Me	Me	H	H	1	H	H			
Me Me H H 1 H		Me	Me	H	H	1	H	H			
Me Me H H 1 H		Me	Me	H	H	1	H	H			1
Me Me H H 1 H		Me	Me	H	H	1		1	B		
Me Me H H 1 H	ı	Me	Me	H	H	1			9	1	1
Me Me H H 1 H H H H NH2 Pr-i Me Me H H 1 H H H NHMe Pr-i Me Me H H 1 H H H NMe2 Pr-i Me Me H H 1 H H H NMe2 Pr-i Me Me H H 1 H H H NMe2 Pr-i Me Me H H 1 H H NHPh Pr-i Me Me H H 1 H H H N(Me)Ph Pr-i Me Me H H 1 H		Me	Me	H	H	1	H	H	H		1 1
Me Me H H 1 H H H H NHMe Pr-i Me Me H H 1 H H H NMe2 Pr-i Me Me H H 1 H H H NHEt Pr-i Me Me H H 1 H H H NHPh Pr-i Me Me H H 1 H			Me		H	1	H	H	H	1	
Me Me H H 1 H H H H NMe2 Pr-i Me Me H H 1 H H H NHEt Pr-i Me Me H H 1 H H H NHPh Pr-i Me Me H H 1 H H H N(Me)Ph Pr-i Me Me H H 1 H H H CN Pr-i Me Me H H 1 H H H H CN Pr-i		Me	Me	H	H	1	H	H	1		
Me Me H H 1 H H H NHEt Pr-i Me Me H H 1 H H H NEt ₂ Pr-i Me Me H H 1 H H NHPh Pr-i Me Me H H 1 H H H N(Me)Ph Pr-i Me Me H H 1 H H H CN Pr-i		Me	Me	H	H	1	H	H	H		
Me Me H H I H H H H NHEt Pr-i Me Me H H I H <td< td=""><td></td><td>Me</td><td>Me</td><td>H</td><td>H</td><td>1</td><td>H</td><td>H</td><td>H</td><td>i .</td><td></td></td<>		Me	Me	H	H	1	H	H	H	i .	
Me Me H H 1 H H H H NEt2 Pr-i Me Me H H 1 H H H NHPh Pr-i Me Me H H 1 H H H N(Me)Ph Pr-i Me Me H H 1 H H H CN Pr-i)	ł	H	H	1	H	H	1	I .	
Me Me H H 1 H H H NHPh Pr-i Me Me H H 1 H H H N(Me)Ph Pr-i Me Me H H 1 H H H CN Pr-i		ľ	3		H	1	H	H	H	1	Pr-i
Me Me H H 1 H H H H N(Me)Ph Pr-i Me Me H H 1 H H H H CN Pr-i			1		H	1	H	H	H		Pr-i
Me Me H H 1 H H H CN Pri						1	H	H	H	N(Me)Ph	Pr·i
1		1			H	1	H	H	H	h .	Pr-i
		Me	Me		H	1	H	H	H	F	Pr-c

اعدا	70.5	77]	77	,)	н	ΗÌ	н	Cl	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	Pr-c
Me	Me	H	H H	1	H	H	H	OMe	Pr·c
Me	Me Me	H	H	1	H	H	H	OEt	Pr·c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	Pr·c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	Pr·c
Me Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	Pr-c
Me	Me	H	H	i	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Pr·c
Me	Me	H	H	i	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Pr-c
Me	Me	H	H	\mathbf{i}	H	H	H	OCH ₂ Pen·c	Pr·c
Me	Me	H	H	i	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Pr·c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	Pr·c
Me	Me	H	H	. 1	H	H	H	OCH ₂ Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	i	H	H	H	OPh	Pr·c
Me Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	Pr·c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	Prc
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	Prc
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Et	Pr·c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Pr·c
Me	Me	H	H	1	Н	H	\mathbf{H}	SPh	Pr·c
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	SO ₂ Ph	Pr·c
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	SCHF ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	1	Н	H	H	SO ₂ CHF ₂	Pr-c
Me	Me	H	Н	1	H	H	\mathbf{H}	NH ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	Pr·c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe_2	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt ₂	Pr·c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	Pr·c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	Pr·c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	$ \mathbf{H} $	H	OEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	CHF ₂

Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	$\bar{1}$	H	H	H	SH	CHF_2
Me	Me	H	H	$\bar{1}$	Н	H	H	SMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	SO ₂ Me	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	SPr-i	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	SCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH_2	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	$ \mathbf{H} $	H	NMe ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
		H	H	1	H	H	H	1	3
l l	1	H	H	1	H	H	H	OHex-c	1
	1	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	
1		4	1	1	H	H	H	OPh	CF ₃
	1			1	H	H	H	OCHF ₂	CF ₃
Me Me Me Me Me Me	Me Me Me Me Me Me	H	H	1 1 1 1	H H H	H H H	H H H	OPen-c OHex-c OCH ₂ Ph OPh	CF ₃ CF ₃

Me	Me	нΙ	н	1 }	н	H	н	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	ī	H	H	H	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	$\bar{\mathbf{i}}$	H	H	H	SO_2Et	CF ₃
Me	Me	H	H	ī	H	H	H	SPr·i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Н	H	H	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$SCHF_2$	CF ₃
Me	Me	H	H	1	\mathbf{H}	H	H	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe_2	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt_2	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	OMe
Me	Me	H	H	1	H	$ \mathbf{H} $	H	OMe	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	OEt	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	ОМе
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex·c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	OMe OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	OMe OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe SO-Mo	
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	OMe OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Ph	OMe

WO 02/062770 PCT/JP02/01015

Me	Me	H	H	1	H	H	H	$SCHF_2$	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OMe
Me	Me	Н	H	1	H	H	H	NH_2	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	OMe
Me	Me	H	H	1	\mathbf{H}	H	H	NMe ₂	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	NHEt	OMe
Me	Me	Н	H	1	\mathbf{H}	H	H	NEt_2	OMe
Me	Me	Н	H	1	H	H	H	NHPh	OMe
Me	Me	н	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OE t	OPh
Me	Me	Н	H	1	H	H	H	OPr-i	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	OPh
Me	Me	H	Н	1	H	H	\mathbf{H}	OCH ₂ Pr-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	OCH ₂ Bu-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	OPh	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Ph	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SCHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	' H	NH_2	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	Н	NHMe	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe ₂	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt ₂	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	OPh

Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	OPh
Me	Me	H	H	1	H	\mathbf{H}	H	\mathbf{F}	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	\mathbf{OEt}	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	\mathbf{OPr}	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	Н	H	H	OPen-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	OHex-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	OCH_2Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	\mathbf{OPh}	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	$ \mathbf{H} $	H	OCHF ₂	$ OCHF_2 $
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	SH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	SMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	SO ₂ Me	OCHF ₂
Me	Me	H	\mathbf{H}	1	H	$ \mathbf{H} $	H	SEt	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	\mathbf{H}	SO ₂ Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SCHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH_2	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	F	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Cl	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OBu-t	CF_3

Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH ₂ Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH ₂ Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH ₂ Pen-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH ₂ Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OPen-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OHex-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH₂Ph	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OPh	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	$OCHF_2$	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SH	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO ₂ Me	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SEt	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO₂Et	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SPr-i	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO ₂ Pr-i	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SPh	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO ₂ Ph	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SCHF ₂	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO ₂ CHF ₂	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NH ₂	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NHMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NHEt	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NEt ₂	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NHPh	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	N(Me)Ph	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	CN	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	$ \mathbf{H} $	ОМе	F	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	$ \mathbf{H} $	OMe	Cl	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OH	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	ОМе	OMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	ОМе	OEt	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OPr-i	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OPr	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OBu-t	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCH ₂ Pr-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	ОМе	OCH ₂ Bu-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCH ₂ Pen-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCH ₂ Hex-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OPen-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OHex-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	Н	H	OMe	OCH ₂ Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H		OPh	CF_3
			•	•	•	•	•	,	- 1

								•	
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO ₂ Pr-i	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	$SCHF_2$	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO ₂ CHF ₂	CF_3
Me	Me	H	H	1	\mathbf{H}	H	OMe	NH ₂	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NEt_2	CF ₃
Me	Me	$\mid \mathbf{H} \mid$	H	1	H	H	OMe	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	CN	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	F	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	Cl	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OEt	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OPr	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OBu-t	CF ₈
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OHex-c	CF3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SO ₂ Me	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SO ₂ Pr-i	CF ₃

	Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SPh	$\mathbf{CF_3}$
	Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	$\mathrm{SO}_2\mathrm{Ph}$	$\mathbf{CF_3}$
	Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SCHF ₂	$\mathbf{CF_3}$
	Me	Me	H	H	1	H	Н	SMe	SO ₂ CHF ₂	$\mathbf{CF_3}$
	Me	Me	H	H	1	\mathbf{H}	Н	SMe	$\mathrm{NH_2}$	$\mathbf{CF_3}$
	Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NHMe	$\mathbf{CF_3}$
	Me	Me	H	H	1	\mathbf{H}	H	SMe	NMe_2	$\mathbf{CF_3}$
	Me	Me	H	H	1	\mathbf{H}	H	SMe	NHEt	$\mathbf{CF_{8}}$
	Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NEt_2	$\mathbf{CF_3}$
	Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NHPh	$\mathbf{CF_{8}}$
	Me	Me	H	H	1	\mathbf{H}	H	SMe	N(Me)Ph	$\mathbf{CF_3}$
	Me	Me	H	H	1	\mathbf{H}	H	SMe	CN	$\mathbf{CF_3}$
	Me	Me	H	H	1	\mathbf{H}	H	SO ₂ Me	F	$\mathbf{CF_3}$
	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	Cl	$\mathbf{CF_3}$
l	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OH	$\mathbf{CF_3}$
l	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OMe	$\mathbf{CF_3}$
l	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OEt	$\mathbf{CF_3}$
l	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OPr-i	$\mathbf{CF_3}$
l	Me	Me	Н	H	1	H	H	SO ₂ Me	OPr	$\mathbf{CF_3}$
l	Me	Me	Н	H	1	H	H	SO ₂ Me	OBu-t	$\mathbf{CF_3}$
ı	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Pr-c	$\mathbf{CF_3}$
l	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Bu-c	$\mathbf{CF_3}$
l	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Pen-c	$\mathbf{CF_{3}}$
۱	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Hex-c	$\mathbf{CF_3}$
l	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OPen-c	$\mathbf{CF_3}$
۱	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OHex-c	$\mathbf{CF_3}$
I	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OCH_2Ph	$\mathbf{CF_3}$
١	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OPh	$\mathbf{CF_3}$
۱	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OCHF ₂	$\mathbf{CF_3}$
ı	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SH	$\mathbf{CF_8}$
I	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SMe	CF ₃
I	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me		CF ₃
I	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SEt	$\mathbf{CF_3}$
	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	_	$\mathbf{CF_3}$
	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SPr-i	$\mathbf{CF_8}$
1	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Pr·i	CF ₃
	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SPh	CF ₃
	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	I .	CF_3
	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	ł	$\mathbf{CF_3}$
	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ CHF ₂	CF ₈
	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	$\mathrm{NH_2}$	CF ₈
	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	NHMe	CF ₃
	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	NMe_2	CF ₈
	Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	NHEt	$\mathbf{CF_3}$

Me	Me	H	H	1	H	н	SO ₂ Me	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	i	H	H	SO_2Me	NHPh	CF ₃
Me Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	i	H	H	SO_2Me	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	F	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	C1	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	$\bar{1}$	H	H	NH ₂	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	ī	H	H	NH_2	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	ī	H	H	NH ₂	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	i	H	H	NH_2	$\mathbf{OBu-t}$	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	ī	H	H	NH ₂	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	ī	H	H	NH_2	OCH ₂ Bu·c	CF ₃
Me	Me	H	H	ī	H	H	NH_2	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	Н	NH ₂	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OCH_2Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OPh	CF ₈
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	.1	H	H	NH ₂	SH	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SO_2Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SO ₂ Et	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SPr-i	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H		SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	_	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	t .	NH ₂	CF ₈
Me	Me	H	H	1	H	H	1	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	1	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	4	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	1	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H		NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	1	N(Me)Ph	CF ₈
Me	Me	H	H	1	H	H	l l	CN	CF ₃
H	H	H	H	1	H	H	4	OMe	CF ₃
H	H	H	H	1	H	H		OEt	CF ₃
Me	H	H	H	1	H	H	1	OMe	CF ₃
Me	H	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃

Me	H	Me	H	1	H	H	H	ОМе	CF ₃
Me	H	Me	H	1	H	H	H	OEt	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	1	Me	$ \mathbf{H} $	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Me	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Et	\mathbf{H}	H	ОМе	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Et	H	H	\mathbf{OEt}	CF_3
Me	Me	H	H	1	Pr·i	H	H	H	CF_3
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	H	ОМе	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Pr-i	$ \mathbf{H} $	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	Me	Me	H	ОМе	CF_3
Me	Me	H	H	1	Me	Me	H	OEt	$\mathbf{CF_3}$
Me	Et	H	H	1	H	$ \mathbf{H} $	H	OMe	CF_3
Me	Et	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Et	Et	H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
Et	Et	H	H	1	Η	H	H	OEt	CF ₈
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Pr•i	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Pr	H	H	1	H	H	H	ОМе	CF ₃
Me	Pr	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	H	ОМе	CF ₃
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	CH ₂ Pr-	н	H	1	H	H	H	ОМе	CF ₃
Me	CH₂Pr- c	н	Н	1	н	н	Н	OEt	CF3
-((CH ₂) ₂ ·	H	н	1	Н	H	Н	OMe	CF3
	$CH_2)_2$	H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
	$CH_2)_3$	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
	$CH_2)_3$ -	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
	$CH_2)_4$ -	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
	$CH_2)_4$	H	Н	1	H	H	H	OEt	CF ₃
	$CH_2)_5$	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
	$CH_2)_5$ -	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CF	[2)3-	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CF		H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CF		H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CF		H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CH	$I_2)_5$ -	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CF		H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CF		H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CI		H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Н	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	Cl

Me	Me	H	H	0	H	\mathbf{H}	н	OEt	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	\mathbf{OPr}	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	.H	OCH ₂ Bu ⁻ c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Cl
Me	Me	\mathbf{H}	H	0	H	H	H	OPen-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Ph	Cl
Me	Me	H	Н	0	H	H	H	OPh	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$OCHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	Cl
Me	Me .	H	H	0	H	H	H	SO_2Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	Cl
Me	Me	H.	H	0	H	H	\mathbf{H}	SO ₂ CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH_2	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	Cl.
Me	Me	H	H	. 0	H	H	H	NEt ₂	C1
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	CI
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	C1
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F.	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex·c	Me

	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	Me
1	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	Me
I	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	Me
I	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	Me
١	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	Me
1	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	Me
l	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	Me
l	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	Me
١	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	Me
I	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Me
ĺ	Me	Me	H	H	0	Η	H	H	SPh	Me
ļ	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Ph	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	Me
l	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Me
Ì	Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH ₂	Me
l	Me	Me	H	H	0	H	$ \mathbf{H} $	H	NHMe	Me
1	Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	Me
١	Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt_2	Me
l	Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	Me
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	Me
I	Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	Me
Į	Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	Pr-i
1	Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	Pr-i
İ	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	Pri
I	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	Pri
I	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	Pr-i
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	Pr-i
1	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	Pr-i
l	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	Pri
I	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Pr-i
١	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Pri
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Pri
١	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Pr i
I	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	Pr-i
١	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	Pri
Ì	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	Pri
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	Pri
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	Pri
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	Pri
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	Pri
ı	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	Pri

Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	Pr·i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	Pr·i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr·i	Pri
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$SCHF_2$	Pri
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH_2	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	н	NMe ₂	Pr·i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	Pr·i
Me	Me	H	H	0	H	H	н	NEt_2	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	Pri
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	Pr·i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	Pr-c
Me	Me	H	H	o	H	H	н	OH	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	Pr·c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	\mathbf{OEt}	Pr-c
Me	Me	H	н	0	H	$ \mathbf{H} $	H	OPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	OBu-t	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu·c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	Pr·c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	Pr·c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	Pr·c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	Pr·c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	Pr·c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Et	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	Pr·c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Pr·c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Ph	Pr·c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	Pr·c
Me	Me	H	H	0	H	H	1	SO ₂ CHF ₂	Pr-c
,	,	,			•	•	•	•	•

Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH ₂	Pr-c
Me	Me	н	H	0	H	H	H	NHMe	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	Pr-c
Me	Me	н	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	н	CN	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	- H	0Pr	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	Η	H	H	OCH ₂ Hex-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	Η	H	H	SH	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	Η.	SMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH_2	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	Η	H	H	NHEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	CHF ₂

				_					
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	. H	OH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	OMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	\mathbf{H}	0	H	H	H	OEt	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	CF_3
Me	Me	\mathbf{H}	H	0	H	H	H	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	OCH ₂ Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	OCH ₂ Bu-c	CF_3
Me	Me	H	\mathbf{H}	0	H	H	H	OCH ₂ Pen·c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	OCH ₂ Hex-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	OHex-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	OCH ₂ Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	$\mid \mathbf{H} \mid$	\mathbf{H}	OCHF ₂	· CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	$\mid \mathbf{H} \mid$	\mathbf{H}	SMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OMe

Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	OCH ₂ Bu-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	OCH ₂ Hex-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	OPen-c	ОМе
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	OHex-c	OMe
Me	Me	$\mid H \mid$	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	OPh	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	\mathbf{H}	OCHF ₂	OMe
Me	Me	H	Η	0	H	H	H	SH	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Ph	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2CHF_2	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH ₂	ОМе
Me	Me	H	Η	0	H	H	H	NHMe	ОМе
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	ОМе
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt ₂	ОМе
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	ОМе
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	ОМе
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Ph	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	OPh

	Me	Me !	нΙ	н	0	н	ΗÌ	H	SMe	OPh	ļ
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	OPh	
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	OPh	
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Et	OPh	!
l	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	OPh	
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OPh	ĺ
١	Me	Me	H	H	0	H	\mathbf{H}	H	\mathtt{SPh}	OPh	
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Ph	OPh	
	Me	Me	H	H	0	H	\mathbf{H}	H	SCHF ₂	OPh	ŀ
١	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2CHF_2	OPh	
l	Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH_2	OPh	
١	Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	OPh	
١	Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe_2	OPh	
l	Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	OPh	
l	Me	Me	H	H	. o l	H	H	H	$\mathbf{NEt_2}$	OPh	ŀ
l	Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	OPh	ļ
ļ	Me	Me	H	н	0	H	H	H	N(Me)Ph	OPh	ļ
١	Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	OPh	
l	Me	Me	$\mid \mathbf{H} \mid$	H	0	H	H	H	\mathbf{F}	$ OCHF_2 $	
l	Me	\mathbf{Me}	H	H	0	H	H	H	\mathbf{OH}	OCHF ₂	
١	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	OCHF ₂	
I	Me	Me	H	H	0	H	$ \mathbf{H} $	H	OEt	$ OCHF_2 $	
١	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	OCHF ₂	
١	Me	Me	H	H	0	H	H	H	\mathbf{OPr}	OCHF ₂	
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	OCHF ₂	
ı	Me	Me	H	\mathbf{H}	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OCHF ₂	
ł	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OCHF ₂	
١	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OCHF ₂	ĺ
Į	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OCHF ₂	ı
-	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	OCHF ₂	ĺ
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	OCHF ₂	ı
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	OCHF ₂	
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	OCHF ₂	l
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	OCHF ₂	l
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	OCHF ₂	ı
,	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	OCHF ₂	
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	OCHF ₂	l
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	OCHF ₂	ĺ
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	OCHF ₂	ļ
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	OCHF ₂	
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OCHF ₂	
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	OCHF ₂	1
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Ph	OCHF ₂	l
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	OCHF ₂	

1		1	1	_ 1		ا ۔۔۔۔ ا			l o arrn
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH_2	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe_2	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$\mathbf{NEt_2}$	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	Ő	H	H	Ĥ	N(Me)Ph	OCHF ₂
Me	Me	$\mid \mathbf{H} \mid$	H	0	H	H	H	CN	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	F	CF_3
Me	Me	$\mid \mathbf{H} \mid$	H	0	H	H	Me	Cl	$\mathbf{CF_{8}}$
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Мe	H	H	0	H	H	Me	OEt	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	Η	0	H	H	Me	OPr	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH ₂ Pr-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH ₂ Bu-c	CF_3
Ме	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Ме	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH ₂ Hex·c	$\mathbf{CF_3}$
Ме	Me	H	H	0	H	H	Me	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH ₂ Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	Η	0	H	H	Me	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SO ₂ Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	$\mathrm{SO}_2\mathrm{Ph}$	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SCHF ₂	CF ₈
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SO_2CHF_2	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	$ m NH_2$	CF ₃
Ме	Me	H	H	0	H	H	Me	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NEt_2	CF ₃
Me	Me	H	H	Ŏ	H	H	Me	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	N(Me)Ph	CF ₃

Me	Me	H	н	0	н	H	Me	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	o l	H	H	OMe	F	CF_3
Me	Me	H	H	ŏ	H	H	OMe	· Cl	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	o l	H	н	OMe	OH	CF_3
Me	Me	H	H	ŏ	H	H	OMe	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	o l	H	H	OMe	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	o l	H	H	OMe	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Η	H	OMe	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	0	\mathbf{H}	H	OMe	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	Н	0	H	H	OMe	OCH ₂ Pr-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	\mathbf{H}	$ \mathbf{H} $	OMe	OCH ₂ Bu-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCH ₂ Pen-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCH ₂ Hex·c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	ОНех-с	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	н	0	H	H	OMe	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OPh	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	\mathbf{H}	H	OMe	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	. 0	H	H	OMe	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe OMe	NH ₂ NHMe	$ ext{CF}_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	Н	OMe	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	l .		H	H	OMe	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	F	CF ₃
Me	Me	•		0	H	H	SMe	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Н	0	H	H	SMe	OEt	CF ₃
Me	Me	1	Н	1 .	H	H	SMe	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OPr	CF ₃
Me	Me	H	l u	0	l U	1 11	DIME	, 011	1 013

Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OBu-t	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OCH ₂ Pr-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	$\mid \mathbf{H} \mid$	H	0	\mathbf{H}	H	SMe	OCH ₂ Bu-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	\mathbf{H}	H	SMe	OCH ₂ Pen-c	$-\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	\mathbf{H}	$ \mathbf{H} $	SMe	OCH ₂ Hex-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OPen-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OHex-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe ⁻	OCH_2Ph	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OPh	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	$OCHF_2$	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SH	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SO₂Me	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	${f SEt}$	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	$\mathrm{SO}_2\mathrm{Et}$	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SPr-i	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SO ₂ Pr-i	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SPh	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	$\mathrm{SO}_2\mathrm{Ph}$	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SCHF ₂	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SO_2CHF_2	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H.	0	H	H	SMe	$ m NH_2$	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NHMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	F	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	CI	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me		CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Ph	CF_3

Me	Me	\mathbf{H}	H	0	H	H	SO ₂ Me	OPh	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	$OCHF_2$	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SH	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SO_2Me	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	\mathbf{SEt}	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SO_2Et	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SPr-i	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Pr-i	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SPh	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	SO_2Ph	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	\mathbf{H}	H	SO ₂ Me	$SCHF_2$	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	SO_2CHF_2	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	NH_2	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	NHMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	NMe_2	$\mathbf{CF_3}$
Me	${f Me}$	H	\mathbf{H}	0	H	H	SO ₂ Me	\mathbf{NHEt}	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	$\mathbf{NEt_2}$	$\mathbf{CF_3}$
.Me	Me	H	H	0	H	Η	SO_2Me	NHPh	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	\mathbf{H}	0	H	H	SO_2Me	N(Me)Ph	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	CN	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	F	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	$ \mathbf{H} $	NH ₂	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OPr·i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OBu-t	$\mathbf{CF_{8}}$
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OCH ₂ Bu ⁻ c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OCH ₂ Hex-c	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OHex-c	$\mathbf{CF_8}$
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OCH_2Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OPh	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	$OCHF_2$	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	∙ 0	H	H	NH_2	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SO_2Me	$\mathbf{CF_3}$
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SO_2Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H		SPr-i	CF ₃

Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	$\mathrm{NH_2}$	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	NH_2	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	NHMe	CF_3
Me	Me	н	H	0	H	H	NH_2	NMe ₂	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	$\mathrm{NH_2}$	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	NEt ₂	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	Н	H	0	H	H	NH_2	CN	CF ₃
H	H	н	H	0	H	H	H	OMe	CF_3
H	Н	Н	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	H	н	H	0	H	H	H	ОМе	CF ₃
Me	H	H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
Me	H	Me	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	0	H	H	\mathbf{H}	OEt	CF ₃
Me	Me	H	Н	0	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Me	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Et	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Et	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	H	H	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	Me	Me	H	ОМе	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Me	Me	H	OEt	CF ₃
Me	Et	H	H	0	H	H	H	ОМе	CF ₃
Me	Et	H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
Et	Et	H	H	0	H	$\mid \mathbf{H} \mid$	H	OMe	CF ₃
Et	Et	H	H	0	H	H	H	OEt	$\mathbf{CF_3}$
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	H	OMe	$\mathbf{CF_3}$
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Pr	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Pr	H	H	0	H	H	H	OEt	$\mathbf{CF_3}$
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
Ме	CH ₂ Pr-	H	H	0	н	H	H	ОМе	CF ₃
Ме	CH.D.		н	0	н	н	H	OEt	CF ₃
	CH ₂) ₂ -	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
-(0	-(CH ₂) ₂ -		H	0	H	H	H	OEt	CF ₃

l -(c	$H_2)_3$ -	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
	$H_2)_3$ -	H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
	$H_2)_4$	H	H	0	H	H	H	ОМе	CF ₃
	$H_2)_4$ -	H	H	0	H	H	H	\mathbf{OEt}	CF ₃
-(C	$H_2)_5$	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
	$H_2)_5$	H	H	0	\mathbf{H}	H	\mathbf{H}	OEt	CF ₃
H	-(CH	2)3-	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CH		H	0	H	H	H	\mathbf{OEt}	CF ₃
H	-(CH		H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
H	·(CH	-(CH ₂) ₄ -		0	H	H	H	OEt	CF ₃
H	$-(CH_2)_5$		H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CH	-(CH ₂) ₅ -		0	Η	H	H	· OEt	CF ₃
H		$-(CH_2)_6$ -		0	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CH		H	0	H	H	H	OEt	CF ₃

表 9

				-		$R^1 \stackrel{R^2}{\longrightarrow} C$	R ³ R ⁴ R ⁶ N S(O) _n C-Y ¹ R ⁵
\mathbb{R}^1	\mathbb{R}^2	R ⁸ I	R4	n	R ⁵	Ke.	Y1
Me	Me	HH	I	2	H	H	Pyridin-2-yl
Me	Me	HH	I	2	H	J.	Pyridin-2-yl 1-oxide
Me	\mathbf{Me}	HH	I	2	H	H	Pyridin-4-yl
Me	\mathbf{Me}	HE	E	2	H	H	Pyridin-4-yl 1-oxide
Me	${f Me}$	HH	E	2	H	H	1,2,4-Oxadiazol-3-yl
Me	Me	HH	H	2	H	H	3-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl
Me	Me	HH	E	2	H	H	3-Benzyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl
Me	Me	$\mid \mathbf{H} \mid \mathbf{H}$	H	2	H	H	2-Chlorothiazol-4-yl
Me	Me	H	H	2	H	H	5-Trifluoromethyl-1,3,4-thiadiazol-2-yl
Me	. Me	HH	H	2	H	H	1,4-Dimethylimidazol-5-yl
Me	\mathbf{Me}	HH	$H \mid$	2	H	H	1-Phenyl-4-methoxycarbonyl-1,2,3-triazol-5-yl
Me	Me	HH	H	2	н	H	1-Diffluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl
Me	Me	H	Η	2	H	H	1-Diflluoromethyl-1,2,4-triazol-5-yl
Me	Me	HI	H	2	н	H	4-Diflluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl
Me	Me	H	H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Me	H	Ηİ	2	H	H	4,6-Diethoxypyrimidin-2-yl
Me	Me	H	H	2	Н	H	4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl
Me	Me	H	нΙ	2	H	H	4-Chloro-6-methylpyrimidin-2-yl
Me	Me	1 1	н	2	H	H	4-Methoxy-6-methylpyrimidin-2-yl
Me	Me	1 1	H	2	H	H	4-Difluoromethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl

Me	Me	н	H	2	H	н	4-Phenoxy-6-methylpyrimidin-2-yl
Me	Me		H	2	H	H	4-Chloro-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl
Me	Me		H	2	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl
Me	Me		H	2	H	H	4-Difluoromethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl
Me	Me	H	H	2	H	H	4-Phenoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl
H	H		H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	H		H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	H	Me		2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Me		H	2	Me	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Me		H	2	Et	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Me		H	2	Pr·i	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Me		H	2	Me		4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Et		H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Et	Et		н	2	H	Н	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Pr-i		н	2	Н	н	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Pr		H	2	H	Н	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Pr-c		H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
1 1	CH ₂ Pr-	1			н	н	
Me	С	H	H	2	п	п	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
-	(CH ₂) ₂ -	H	H	2	H	Н	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
- ($(CH_2)_8$ -	H	H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
	$(CH_2)_4$ -	H	H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
-1	(CH ₂) ₅ -	H	H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
H	-(CH ₂		H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
H	-(CH ₂		H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
H	-(CH ₂		H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
H	-(CH ₂		H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Me	H	H	1	H	H	Pyridin-2-yl
Me	Me	H	\mathbf{H}	1	H	H	Pyridin-2-yl 1-oxide
Me	Me	H	H	1	H	H	Pyridin-4-yl
Me	Me	H	H	1	H	H	Pyridin-4-yl 1-oxide
Me		H	H	1	H	H	1,2,4-Oxadiazol-3-yl
Me	•	H	H	1	H	H	3-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl
Me	Me	H	H	1	H	H	3-Benzyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl
Me	1	H	H	1	H	H	2-Chlorothiazol-4-yl
Me	1	H	H	1	H	H	5-Trifluoromethyl-1,3,4-thiadiazol-2-yl
Me		H	H	1	H	H	1,4-Dimethylimidazol-5-yl
Me		H	H	1	H	H	1-Phenyl-4-methoxycarbonyl-1,2,3-triazol-5-yl
Me	1	H	H	1	H	H	1-Difluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl
Me	1	H	H	1	H	H	1-Diffluoromethyl-1,2,4-triazol-5-yl
Me		H	H	1	H	H	4-Difluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl
Me		H	H	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	I	H	H	1	H	H	4,6-Diethoxypyrimidin-2-yl
Me	1	H	H	1	H	H	4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl
Me	Me	H	H	1	H	H	4-Chloro-6-methylpyrimidin-2-yl

Me	Me	H	H	1	H	H	4-Methoxy-6-methylpyrimidin-2-yl
Me	Me	\mathbf{H}	H	1	H	\mathbf{H}	4-Difluoromethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl
Me	Me	\mathbf{H}	H	1	H	H	4-Phenoxy-6-methylpyrimidin-2-yl
Me	Me	H	H	1	H	H	4-Chloro-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl
Me	Me	H	H	1	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl
Me	Me	H	H	1	H	H	4-Difluoromethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl
Me	Me	H	H	1	H	H	4-Phenoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl
H	н	Н	H	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	н	н	H	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	1	Me	H	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	1	•	H	1	Me	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Me	н	H	1	Æŧ	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	I .	н	H	1	Pr-i	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	4		H	1	Me	Me	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
Me	I .	н	\mathbf{H}	1	H	н	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Et	Et	H	H	1	H	н	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	1	н	H	1	H	Н	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me		H	H	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	•	H	H	1	н	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	CH ₂ Pr-	н	н	1	н	н	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
	(CH ₂) ₂ -	H	H	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
.	(CH ₂) ₃ -	H	H	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
.	·(CH ₂) ₄ -	H	H	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
.	$(CH_2)_5$	H	H	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
H	-(CH	2)3-	H	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
H	-(CH	2)4-	H	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
H	-(CH		H	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
H	-(CH	2)6-	$\ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ $	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Me	H	H	0	H	H	Pyridin-2-yl
Μe	1	H	H	0	H	H	Pyridin-2-yl 1-oxide
Me	Me	H	\mathbf{H}	0	H	H	Pyridin-4-yl
Me	Me	H	H	0	H	H	Pyridin-4-yl 1-oxide
Me	Me	H	H	0	H	H	1,2,4-Oxadiazol-3-yl
Me	Me	H	H	0	H	H	3-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl
Me	Me .	H	H	0	H	H	3-Benzyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl
Me	e Me	H	H	0	H	H	
Me	e Me	H	$ \mathbf{H} $	0	H	H	5-Trifluoromethyl-1,3,4-thiadiazol-2-yl
Me	Me	H	H	0	H	H	
Me		H	H	0	H	H	1-Phenyl-4-methoxycarbonyl-1,2,3-triazol-5-yl
M		H		0	H	H	1-Diflluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl
M	1	H	H	0	H	H	
M		H		0	H	H	4-Diflluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl
M	1	H		0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
M			\mathbf{H}	0	H	H	4,6-Diethoxypyrimidin-2-yl

Me	Me	H	H	0	н I	н	4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl
Me	Me		H	ŏ	H		4-Chloro-6-methylpyrimidin-2-yl
Me	Me	H		0	н	H	4-Methoxy-6-methylpyrimidin-2-yl
Me	Me		H	0	H	н	4-Difluoromethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl
Me	Me		H	o l	H		4-Phenoxy-6-methylpyrimidin-2-yl
Me	Me		H	0	H	H	4-Chloro-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl
Me	Me		H	0	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl
Me	Me		H	0	H	H	4-Difluoromethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl
Me	Me		H	0	H	H	4-Phenoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl
H	H		H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	H	H	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	H	Me	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Me	H	H	0	Me	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Me	H	H	0	Et	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Me	H	H	0	Me	Me	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	$\mathbf{E}t$	H	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Et	Et	H	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	\mathbf{Pr}	H	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Ме	CH ₂ Pr- c	н	н	0	н	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
-((CH ₂) ₂ -	H	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
-((CH ₂) ₃ -	H	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
-($(CH_2)_4$ -	H	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
-($(CH_2)_5$	H	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
H	·(CH:)3-	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
H	·(CH)4-	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
H	-(CH:	2)5-	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
H	-(CH	2)6	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	Pirrol-1-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	Oxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	Thiazol-2-yl
Me	Et	H	•	2	H	H	Thiazol-4-yl
Me	Et	H		2	H	H	1,2,3-Thiadiazol-4-yl
Me	Et	H	1	2	H	H	1,2,3-Thiadiazol-5-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	1,2,4-Thiadiazol-3-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	1,3,4-Thiadiazol-2-yl
Me	Et	H		2	H	H	1,3,4-Thiadiazol-5-yl
Me	Et	H	1	2	H	H	Pyridin-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	1	Pyridin-3-yl
Me	Et	H		2	H	H	Pyridin-4-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	1H-Imidazol-2-yl

Me	Et	H	H	2	H	H	1H-Imidazol-4-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	1H-Imidazol-5-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	1H-1,3,4-Triazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	1H-1,3,4-Triazol-5-yl

表10

$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$											
	$R^1 \longrightarrow R^4$										
Ì	0										
$N = S(O)_{\overline{n}} - C - Y$											
R ⁰											
R^{I}	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹				
Me	Me	H	H	2	H		Benzimidazol-2-yl				
Me	Me	H	H	2	H		Benzothiophen-2-yl				
Me	Me	H	H	2	H	H	3-Chlorobenzothiophen-2-yl				
Me	Me	H	H	2	H	H	Benzotriazol-1-yl				
Me	Ме	н	H	2	H	H	1-Methylindazol-4-yl				
Me	Ме	H	H	2	H	H	Benzothiazol-2-yl				
.Me	Me	H	H	2	H	H	Benzothiophen-3-yl				
Me	Me	Н	H	2	H	Н	5-Chlorobenzothiophen-3-yl				
Me	Me	H	H	2	H	H	Benzoxazol-2-yl				
Me	Me	H	H	2	H	H	3-Methylbenzothiophen-2-yl				
Me	Me	H	H	2	H	Н	3-Bromobenzothiophen-2-yl				
Me	Me	H	H	2	H	H	Benzofuran-2-yl				
Me	Me	Н	H	2	H	H	2-Methylbenzofuran-7-yl				
Me	Me	H	H	2	H	H	3-Bromobenzofuran-2-yl				
Me	Me	H	H	.2	H	H	Benzothiophen-7-yl				
Me	Me	H	H	2	H	H	1-Methylindazol-7-yl				
Me	Me	H	H	2	H	H	1-Difluoromethylindazol-7-yl				
Me	Me	H	H	2	H	H	3-Methylbenzofuran-2-yl				
Me	Me	H	H	2	H	H	3-Chloro-1-methylindol-2-yl				
Me	Me	H	H	1	H	H	Benzimidazol-2-yl				
Me	Me	H	H	1	H	H	Benzothiophen-2-yl				
Me	Me	H	H	1	H	H	3-Chlorobenzothiophen-2-yl				
Me	Me	H	H	1	H	H	Benzotriazol-1-yl				
Me	Me	H	H	1	H	H	1-Methylindazol-4-yl				
Me	Me	H	H	1	H	H	Benzothiazol-2-yl				
Me	Me	H	H	1	H	H	Benzothiophen-3-yl				
Me	Me	H	H	1	H	H	5-Chlorobenzothiophen-3-yl				
Me	Me	H	Н	1	H	H	Benzoxazol-2-yl				
Me	Me	Н	Н	1	H	H	3-Methylbenzothiophen-2-yl				
Me	Me	Н	Н	1	H	H	3-Bromobenzothiophen-2-yl				

Me	Me	Н	Н	1	Н	Н	Benzofuran-2-yl
Me	Me	Н	H	1	H	H	2-Methylbenzofuran-7-yl
Me	Me	H	H	1	H	Н	3-Bromobenzofuran-2-yl
Me	Ме	H	H	1	H	H	Benzothiophen-7-yl
Me	Me	Н	H	1	H	H	1-Methylindazol-7-yl
Me	Me	Н	H	1	H	H	3-Methylbenzofuran-2-yl
Me	Me	Н	H	1	H	Н	3-Chloro-1-methylindol-2-yl
Me	Me	H	H	0	H	Н	Benzimidazol-2-yl
Me	Me	H	H	0	H	H	Benzothiophen-2-yl
Me	Me	H	H	0	H	H	3-Chlorobenzothiophen-2-yl
Me	Me	Н	H	0	H	H	Benzotriazol-1-yl
Me	Me	H	Н	0	H	Н	1-Methylindazol-4-yl
Me	Me	H	Н	0	H	Н	Benzothiazol-2-yl
Me	Me	H	H	0	Н	Η	Benzothiophen-3-yl
Me	Me	Н	H	0	Н	Н	5-Chlorobenzothiophen-3-yl
Me	Me	H	Н	0	Н	H	Benzoxazol-2-yl
Me	Me	H	H	. 0	H	H	3-Methylbenzothiophen-2-yl
Me	Me	H	H	0	H	H	3-Bromobenzothiophen-2-yl
Me	Me	H	H	0	Н	H	Benzofuran-2-yl
Me	Me	Н	H	0	H	Н	2-Methylbenzofuran-7-yl
Me	Me	H	Н	0	Н	Н	3-Bromobenzofuran-2-yl
Me	Me	Н	H	0	H	H	Benzothiophen-7-yl
Me	Me	H	H	0	H	H	1-Methylindazol-7-yl
Me	Me	H	H	0	H	Ή	3-Methylbenzofuran-2-yl
Me	Me	H	H	0	H	H	3-Chloro-1-methylindol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	Benzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	4-Chlorobenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	5-Chlorobenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	6-Chlorobenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	Н	7-Chlorobenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	Н	4-Fluorobenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	5-Fluorobenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	6-Fluorobenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	7-Fluorobenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	4-Methylbenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	5-Methylbenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	6-Methylbenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	Н	7-Methylbenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	4-Methoxybenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	5-Methoxybenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	Н	2	H	H	6-Methoxybenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	7-Methoxybenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	Benzothiazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	4-Chlorobenzothiazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	5-Chlorobenzothiazol-2-yl

	Me	Et	H	H	2	H		6-Chlorobenzothiazol-2-yl
	Me	Et	H	H	2	H	H	7-Chlorobenzothiazol-2-yl
-	Ме	Et	H	H	2	H	H	4-Fluorobenzothiazol-2-yl
	Me	Et	H	H	2	H	H	5-Fluorobenzothiazol-2-yl
	Me	Et	H	H	2	H	H	6-Fluorobenzothiazol-2-yl
1	Me	Et	H	н	2	H	H	7-Fluorobenzothiazol-2-yl
	Me	Et	H	ΗÌ	2	H	H	4-Methylbenzothiazol-2-yl
١	Me	Et	H	н	2	H	H	5-Methylbenzothiazol-2-yl
	Me	Et	H	н	2	H	H	6-Methylbenzothiazol-2-yl
1	Me	Et	H	н	2	H	H	7-Methylbenzothiazol-2-yl
Ì	Me	Et	н	H	2	H	H	4-Methoxybenzothiazol-2-yl
1	Me	Et	Н	H	2	H	H	5-Methoxybenzothiazol-2-yl
	Me	Et	H	H	2	H	H	6-Methoxybenzothiazol-2-yl
1	Me	Et	H	н	2	H	H	7-Methoxybenzothiazol-2-yl
١	Me	Et	н	H	2	H	H	Qnolin-2-yl
١	Me	Et	н	Н	2	H	H	Qinolin-6-yl
1	Me	Et	H	Н	2	H	H	Quinoxalin-2-yl
١	Me	Et	H	H	2	H	H	Benzofuran-2-yl
I	Me	Et	H	H	2	H	Η	3-Chlorobenzofuran-2-yl
١	Me	Et	H	H	2	H	H	4-Chlorobenzofuran-2-yl
١	Me	Et	Н	H	2	H	Н	5-Chlorobenzofuran-2-yl
1	Me	Et	H	H	2	H	H	6-Chlorobenzofuran-2-yl
	Me	Et	H	н	2	H	H	7-Chlorobenzofuran-2-yl
1	Me	Et	H	H	2	H	H	3-Methylbenzofuran-2-yl
-	Me	Et	H	H	2	H	H	4-Methylbenzofuran-2-yl
ł	Me	Et	H	H	2	H	H	5-Methylbenzofuran-2-yl
1	Me	Et	H	H	2	H	H	6-Methylbenzofuran-2-yl
	Me	Et	H	H	2	H	H	7-Methylbenzofuran-2-yl
ı	Me	Et	H	H	2	H	H	3-Methoxybenzofuran-2-yl
j	Me	Et	H	H	2	H	H	4-Methoxybenzofuran-2-yl
	Me	Et	H	H	2	H	H	5-Methoxybenzofuran-2-yl
	Me	Et	H	H	2	H	H	6-Methoxybenzofuran-2-yl
	Me	Et	H	H	2	H	H	7-Methoxybenzofuran-2-yl

一般式 [I] を有する本発明化合物は、以下に示す製造法に従って製造することができるが、これらの方法に限定されるものではない。

<製造法1> 工程1~工程5

(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びYは前記と同じ意味を表し、X¹はハロゲン原子を表し、R¹はC1~C4アルキル基、置換されていてもよいフェニル基又は 置換されていてもよいベンジル基を表し、Lはハロゲン原子、C1~C4アルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基又は置換されていてもよいベンジルスルホニル基等の脱離基を表し、Xは1以上の整数を表す。)

以下、上記製造方法を各工程毎に詳説する。

(工程1)

10 一般式[5]で表されるスルフィド誘導体は、一般式[1]で表される化合物と、

15

20

25

一般式 [2] で示される水硫化ナトリウム水和物とを、溶媒中又は溶媒の非存在下で(好ましくは適当な溶媒中)、塩基の存在下反応させることにより一般式 [3] で表されるメルカプタンの塩を反応系内で製造した後、メルカプタンの塩 [3] を単離することなく一般式 [4] で表されるハロゲン誘導体とを反応させること(場合によってはラジカル発生剤 [例えばロンガリット(商品名): CH₂ (OH) SO₂ Na・2H₂O等]を添加することができる)によって製造することができる。

反応温度は、いずれの反応も0℃から反応系における還流温度までの任意の温度、 好ましくは10℃ \sim 100℃の温度範囲であり、反応時間は、化合物により異なる が0.5時間 \sim 24時間である。

反応に供される試剤の量は、一般式 [1] で表される化合物1当量に対して、一般式 [2] で表される化合物又は一般式 [4] で表される化合物は1~3当量、塩基を使用する場合は、塩基0.5~3当量である。

溶媒としては、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン(THF)等のエーテル類、ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、N,Nージメチルアセトアミド、N,Nージメチルホルムアミド又はNーメチルー2ーピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール又はtertーブタノール等のアルコール類、アセトン又は2ーブタノン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、水或いはこれらの混合物が挙げられる。

塩基としては、例えば水素化ナトリウム等の金属水素化物、ナトリウムアミド又はリチウムジイソプロピルアミド等のアルカリ金属アミド類、ピリジン、トリエチルアミン又は1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム又は

炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム 等のアルカリ金属重炭酸塩或いはナトリウムメトキシド又はカリウムtertーブト キシド等の金属アルコラートが挙げられる。

(工程2)

10

5 一般式[6]で表されるスルホキシド誘導体は、一般式[5]で表されるスルフィド誘導体と酸化剤とを、適当な溶媒中で反応させることにより製造することができる。

反応温度は、0 \mathbb{C} から反応系における還流温度までの任意の温度、好ましくは 0 \mathbb{C} \sim 6 0 \mathbb{C} の温度範囲であり、反応時間は、化合物により異なるが 1 時間 \sim 7 2 時間である。

反応に供される試剤の量は、一般式 [5] で表される化合物 1 当量に対して酸化剤 1 ~ 3 当量である。

溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン、四塩化 炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、ジオキサ ン、テトラヒドロフラン (THF)、ジメトキシエタン又はジエチルエーテル等の エーテル類、N, Nージメチルアセトアミド、N, Nージメチルホルムアミド又はN ーメチルー2ーピロリジノン等のアミド類、メタノール、エタノール、プロパノー ル、イソプロパノール、ブタノール又はtertーブタノール等のアルコール類、アセ トン又は2ーブタノン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸、水或 20 いはこれらの混合物が挙げられる。

酸化剤としては、例えば、m-クロロ過安息香酸、過ギ酸又は過酢酸等の有機過酸化物、過酸化水素、過マンガン酸カリウム又は過ヨウ素酸ナトリウム等の無機過酸化物が挙げられる。

(工程3)

25 一般式「7]で表されるスルホン誘導体は、一般式「6]で表されるスルホキシ

ド誘導体と酸化剤とを、適当な溶媒中で反応させることにより製造することができる。

反応温度は、0 \mathbb{C} から反応系における還流温度までの任意の温度、好ましくは 0 \mathbb{C} 0 \mathbb{C} の温度範囲であり、反応時間は、化合物により異なるが 1 時間 \mathbb{C} \mathbb{C} 7 \mathbb{C} 時間である。

反応に供される試剤の量は一般式[6]で表される化合物1当量に対して酸化剤は1~3当量である。

溶媒及び酸化剤としては、工程2と同様なものが挙げられる。

(工程4)

5

15

10 一般式[7]で表されるスルホン誘導体は、適当な溶媒中、一般式[5]で表されるスルフィド誘導体と好適な量の酸化剤により、一般式[6]で表されるスルホキシド誘導体を単離することなく製造することもできる。

反応温度は、0 \mathbb{C} から反応系における還流温度までの任意の温度、好ましくは 0 \mathbb{C} 0 \mathbb{C} 0 \mathbb{C} の温度範囲であり、反応時間は、化合物により異なるが 1 時間 \mathbb{C} \mathbb{C} \mathbb{C} 時間である。

反応に供される試剤の量は、一般式 [5] で表される化合物1当量に対して酸化剤1~3当量である。

溶媒及び酸化剤としては、工程2と同様なものが挙げられる。

(工程5)

20 一般式[5]で示されるスルフィド誘導体は、一般式[8]で表される化合物と、一般式[9]で示されるメルカプタン誘導体とを、溶媒中又は溶媒の非存在下で(好ましくは適当な溶媒中)、塩基の存在下で反応させることにより製造することもできる。

~24時間である。

反応に供される試剤の量は、一般式[8]で表される化合物1当量に対して、一般式[9]で表される化合物1~3当量、塩基0.5~3当量である。

溶媒としては、例えばジエチルエーテル、ジメトキシエタン、ジオキサン又はテトラヒドロフラン(THF)等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、N,Nージメチルアセトアミド、N,Nージメチルホルムアミド又はNーメチルー2ーピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール又はtertーブタノール等のアルコール類、アセトン又は2ーブタノン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、水或いはこれらの混合物が挙げられる。

塩基としては、例えば水素化ナトリウム等の金属水素化物、ナトリウムアミド又はリチウムジイソプロピルアミド等のアルカリ金属アミド、ピリジン、トリエチルアミン又は1,8ージアザビシクロ[5.4.0]-7ーウンデセン等の有機塩基、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩或いはナトリウムメトキシド又はカリウムtertープトキシド等の金属アルコラートが挙げられる。

一般式[8]で示される化合物のうちLがハロゲン原子で表される化合物[12]は、工程6で示される方法により製造することができ、必要に応じ[12]と[13]を分離精製して化合物[12]を得る。

(工程6)

(式中、X¹、R¹, R², R³及びR⁴は前記と同じ意味を表す。)

一般式 [12] 及び [13] で表されるイソオキサゾリン化合物は、一般式 [10] で表されるオレフィン誘導体と、一般式 [11] で示されるオキシム誘導体とを、溶媒中又は溶媒の非存在下で(好ましくは適当な溶媒中)、塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。但し、R³, R⁴の両者が水素原子の場合には一般式 [12] で表されるイソオキサゾリン化合物が優先的に得られる。

反応温度は、0℃から反応系における還流温度までの任意の温度、好ましくは10℃~80℃の温度範囲であり、反応時間は、化合物により異なるが0.5時間~2週間である。

反応に供される試剤の量は一般式[11]で表される化合物1当量に対して、一般式[10]で表される化合物は1~3当量である。

溶媒としては、例えばエチレングリコールジメチルエーテル、エチレングリコールジエチルエーテル、ジエチルエーテル、ジオキサン又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類、酢酸エチル又は酢酸プチル等の酢酸エステル類、水或いはこれらの混合物等が挙げられる。

20 塩基としては、例えば水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、

炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩、酢酸ナトリウム又は酢酸カリウム等のアルカリ金属酢酸塩、フッ化ナトリウム又はフッ化カリウム等のアルカリ金属のフッ素化塩或いはピリジン、トリエチルアミン又は1,8-ジアザビシクロ[5.

5 4.0] - 7 - ウンデセン等の有機塩基等が挙げられる。

尚、上記製造方法で用いる製造中間体である一般式[10]で表される化合物は、 市販のものを用いるか、又は、ウィッティヒ(Wittig)反応等の公知の反応により 製造することができる。又、一般式[11]で示される化合物は、例えば、Liebigs Annalen der Chemie, 985 (1989) に記載の方法に準じて製造することができる。

10 一般式[1]で表される化合物は、前記に示した一般式[12]で表される化合物から以下の方法により製造することができる。

(式中、X¹、R¹、R²、R³、R⁴及びR⁷は前記と同じ意味を表す。)

15 一般式[15]で表される化合物は前記記載の工程5、一般式[16]で表される化合物は前記記載の工程2、一般式[1]で表される化合物は化合物[15]か

ら前記記載の工程4又は化合物 [16]から工程3で示した方法に準じ製造することができる。

溶媒、塩基及び酸化剤としては、工程2、工程3、工程4又は工程5で記載した ものと同じものが挙げられる。

5 一般式 [4] で表される化合物中のR⁶が水素原子のものである、一般式 [21] で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

(式中、 R^5 、 X^1 及びYは前記と同じ意味を表し、 R^8 はアルキル基を表す。) (工程 1 1)

10 一般式 [20] で表される化合物は、化合物 [17]、 [18] 又は [19] と 還元剤とを溶媒中で反応することにより製造することができる。

この反応は通常、反応温度-60~150℃で10分~24時間反応させる。

反応に供される試剤の量は、化合物 [17]、[18] 又は [19] 1当量に対して、還元剤 0.5~2当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

還元剤としては、[17]から[20]の製造では、例えば水素化ジイソプチルアルミニウム等の金属水素化物、或いは水素化ホウ素ナトリウム又は水素化リチウムアルミニウム等の金属水素錯化合物が、[18]又は[19]から[20]の製造では、例えば水素化ジイソプチルアルミニウム等の金属水素化物、水素化ホウ素

ナトリウム又は水素化リチウムアルミニウム等の金属水素錯化合物、或いはジボランが挙げられる。

溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、ベンゼン又はトルエン等の芳香族炭化水素類、メタノール又はエタノール等のアルコール類が挙げられる。

(工程12)

15

一般式[21]で表される化合物は、化合物[20]とハロゲン化剤とを溶媒中で反応させることにより、製造することができる。

この反応は通常、反応温度-50~100℃で10分~24時間行う。

10 反応に供される試剤の量は、化合物[20]1当量に対して、ハロゲン化剤1~3当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

ハロゲン化剤としては、例えば塩化水素、臭化水素、三塩化リン、三臭化リン又は塩化チオニル等が挙げられる。

溶媒としては、例えばジクロロエタン又は四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、 酢酸等の酸類或いはテトラヒドロフラン等のエーテル類が挙げられる。

一般式 [4] で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

(式中、R⁵、R⁶、X¹及びYは前記と同じ意味を表す。)

20 一般式 [4] で表される化合物は、化合物 [22] とハロゲン化剤とを溶媒中、 触媒の存在下又は非存在下で反応させることにより製造することができる。

この反応は通常、反応温度30~150℃で10分~24時間反応させる。 反応に供される試剤の量は、化合物[22]1当量に対して、ハロゲン化剤1~ 10 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。触媒は $0.01\sim0.5$ 当量である。

ハロゲン化剤としては、例えば臭素又は塩素等のハロゲン、Nープロモコハク酸イミド等のNーハロコハク酸イミド、或いは過臭化ピリジニウム等のピリジン塩等が挙げられる。

溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、N, Nージメチルアセトアミド、N, Nージメチルホルムアミド又はNーメチルー2ーピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、ギ酸、又は酢酸等のカルボン酸類が挙げられる。

触媒としては、例えば過酸化ベンゾイル、 α , α ーアゾビスイソプチロニトリル 又はこれらの混合物が挙げられる。

一般式 [4] で表される化合物中のR⁵及びR⁶が水素原子のものである、一般式 [24] で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

15

5

10

(式中、X¹及びYは前記と同じ意味を表す。)

一般式 [24] で表される化合物は、Org. Synth., III, 557 (1955)又は J. Am. Chem. Soc., 72, 2216 (1950) に記載の方法に準じて、化合物 [23] とハロゲン 20 化水素とホルムアルデヒド又はパラホルムアルデヒドとを溶媒中、ルイス酸存在下もしくは非存在下で反応させるか、或いはJ. Am. Chem. Soc., 97, 6155 (1975) に記載の方法に準じて、化合物 [23] とハロゲノメチルエーテルとを溶媒中、ルイス酸存在下、反応させる方法により製造することができる。

この反応は通常、反応温度-40~150℃で10分~24時間行う。

20

反応に供される試剤の量は、化合物 [23] 1当量に対して、ハロゲン化水素、ホルムアルデヒド、パラホルムアルデヒド、ルイス酸又はハロゲノメチルエーテル。 1~2当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

ルイス酸としては、例えば四塩化チタン、塩化亜鉛、塩化アルミニウム又は臭化 5 亜鉛等が挙げられる。

ハロゲン化水素としては、塩化水素、臭化水素又はヨウ化水素が挙げられる。 溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ヘキサン又はヘプタン等の脂肪族炭化水素類、ジオキサン又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、酢酸等のカルボン酸類、二硫化炭素或いはそれらの混合物が挙げられる。

一般式 [19] で表される化合物中のR⁵が水素原子のものである、一般式 [2 5] で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

15 (式中、Yは前記と同じ意味を表す。)

一般式 [25] で表される化合物は、0rg. Synth., IV, 831 (1963) に記載のビルスマイヤー (Vilsmeier) 法に準じて、化合物 [23] とN, Nージメチルホルムアミドとを塩化ホスホリル、ホスゲン又は塩化チオニル存在下、溶媒中又は溶媒の非存在下で反応させるか、或いはChem. Ber., 93, 88 (1960) に記載の方法に準じて、化合物 [23] とジハロゲノメチルエーテルとを溶媒中、ルイス酸存在下、反応させた後、加水分解させる方法により製造することができる。

この反応は通常、反応温度-40~150°Cで10分~24時間行う。 反応に供される試剤の量は、化合物 [23] 1当量に対して、塩化ホスホリル、

ホスゲン、塩化チオニル、N, Nージメチルホルムアミド、ルイス酸又はジハロゲ ノメチルエーテル1~2当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させる ことができる。

ルイス酸としては、例えば四塩化チタン、四塩化スズ、塩化亜鉛、塩化アルミニ 5 ウム又は臭化亜鉛等が挙げられる。

溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ヘキサン又はヘプタン等の脂肪族炭化水素類、ジオキサン又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、酢酸等のカルボン酸類、N,Nージメチルホルムアミド等のアミド類、二硫化炭素或いはそれらの混合物が挙げられる。

10 一般式 [17]、 [18]、 [19] 及び [20] で表される化合物は、以下の 方法により製造することができる。

(式中、R⁵, R⁶及びYは前記と同じ意味を表し、X²は塩素原子、臭素原子又はヨ 15 ウ素原子を表す。)

一般式 [17]、[18]、[19] 又は [20] で表される化合物は、J. Org. Chem., 65, 4618(2000)に記載方法に準じて、化合物 [26] とマグネシウム試薬とを溶媒中又は溶媒の非存在下、反応させて化合物 [27] を得た後、求電子試薬と反応させるか、或いはSynth. Commun., 24(2), 253(1994)に記載方法に準じて、化合物 [26] とnーブチルリチウムとを溶媒中で反応させて化合物 [28] を得

た後、求電子試薬と反応させる方法により製造することができる。

この反応は通常、反応温度-100~150℃で10分~24時間行う。

反応に供される試剤の量は、化合物 [26] 1当量に対して、マグネシウム試薬 又はリチウム試薬1~5当量、求電子試薬1~5当量が望ましいが、反応の状況に 応じて任意に変化させることができる。

マグネシウム試薬としては、例えば金属マグネシウム、臭化イソプロピルマグネシウム又はジイソプロピルマグネシウム等が挙げられる。

リチウム試薬としては、例えばnーブチルリチウム、secーブチルリチウム又は tertープチルリチウム等が挙げられる。

10 求電子試薬としては、例えばギ酸エチル、シアノギ酸エチル又は酢酸エチル等の エステル類、アセチルクロリド又はクロロギ酸メチル等の酸ハライド類、N,Nー ジメチルホルムアミド等のアミド類、パラホルムアルデヒド等のアルデヒド類、或 いは二酸化炭素が挙げられる。

溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素又はクロロホルム等のハロゲ 15 ン化炭化水素類、ヘキサン又はペンタン等の脂肪族炭化水素類、ジオキサン又はテ トラヒドロフラン等のエーテル類、或いはそれらの混合物が挙げられる。

一般式 [4] 、[17] 、[18] 、[19] 、[20] 、[22] 、[23] 、 [26] 、[32] 又は [34] で表される化合物中、一般式 [31] で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

$$\begin{array}{ccc}
& L^{1} \cdot R^{9} \\
& & [30] \\
Y - OH & \longrightarrow & Y - OR^{9} \\
& [29] & \underline{u}_{\underline{z}} & [31]
\end{array}$$

20

(式中、Yは前記と同じ意味を表し、R[®]はアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキル基、置換

一般式[31]で表される化合物は、化合物[29]と化合物[30]とを溶媒中、塩基存在下で反応させることにより製造することができる。

15 この反応は通常、反応温度0~120℃で10分~24時間行う。

反応に供される試剤の量は、化合物 [29] 1当量に対して化合物 [30] は1~20当量、塩基は1~3当量である。

塩基としては、例えば炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水素化カリウム 20 又は水素化ナトリウム等アルカリ金属水素化物、ナトリウムエトキシド又はナトリウムメトキシド等のアルカリ金属アルコラート、或いは1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基が挙げられる。

溶媒としては例えばジクロロメタン又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素 類、ジエチルエーテル又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン又はトル 25 エン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン又はヘプタン等の脂肪族炭化水素類、アセト ン又はメチルイソブチルケトン等のケトン類、酢酸エチル又は酢酸メチル等のエステル類、Nーメチルピロリドン又はN, Nージメチルホルムアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、アセトニトリル等のニトリル類、或いはそれらの混合物が挙げられる。

5 一般式 [4] 、 [17] 、 [18] 、 [19] 、 [20] 、 [22] 、 [23] 、 [26] 、 [29] 又は [31] で表される化合物中、一般式 [34] で表される 化合物は、以下の方法により製造することができる。

(式中、L¹は前記と同じ意味を表し、R¹ºはアルキル基、前記と同じ意味の置換基 10 群βより選択される任意の基でモノ置換されたアルキル基、ハロアルキル基、シク ロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルキルスルフィニル基、アルキル スルホニル基、前記と同じ意味の置換基群γより選択される任意の基でモノ置換さ れたアルキルスルホニル基、ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいフ エニル基、置換されていてもよい芳香族へテロ環基、置換されていてもよいフェニ 15 ルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族へテロ環スルホニル基、アシル基、 ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換さ れていてもよいベンゾイル基、アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベ ンジルオキシカルボニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、カル バモイル基 (該基の窒素原子は同一又は異なって、アルキル基又は置換されていて 20 もよいフェニル基で置換されていてもよい)を表す。この場合、ピラゾール環の炭 素原子は、前記と同じ意味の置換基群 α より選択される、 $1\sim2$ 個の同一又は相異 なる基で置換されていてもよい。)

一般式[34]で表される化合物は、化合物[32]と化合物[33]とを溶媒中、塩基存在下で反応させることにより製造することができる。

この反応は通常、反応温度 $0\sim1~2~0$ \mathbb{C} で1~0 $5\sim2~4$ 時間反応行う。反応に供される試剤の量は、化合物 1~2~1 当量に対して化合物 1~3~1 は $1\sim2~0$ 当量、

5 塩基は1~3当量である。

25

塩基及び溶媒としては、例えば一般式 [29] から一般式 [31] の製造と同様なものが挙げられる。

Yにトリフルオロメチル基を導入する方法として、J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 8, 2293-2299 (1990)、J. Fluorine Chem., 50(3), 411-426 (1990)、

- J. Chem. Soc. Chem. Commun., 18, 1389-1391 (1993), J. Chem. Soc. Chem. Commun., 1, 53-54 (1992), Chem. Lett., 1719-1720 (1981), Chem. Pharm. Bull., 38(9), 2446-2458 (1990), J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 921-926 (1988), Heterocycles, 37(2), 775-782 (1994), Tetrahedron Lett., 30(16), 2133-2136 (1989), J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 2755-2761 (1980), Heterocycles, 22(1), 117-124 (1984),
- Eur. J. Med. Chem. Chim. Ther., 24, 249-258 (1989), Acta Chem. Scand. Ser. B, 38(6),505-508 (1984), J. Fluorine Chem., 21,495-514 (1982), J. Chem. Soc. Chem. Commun., 10, 638-639 (1988), J. Fluorine Chem., 67(1),5-6 (1994), J. Heterocycl. Chem., 31(6), 1413-1416 (1994), Chem. Heterocycl. Compd., 30(5), 576-578 (1994), J. Fluorine Chem., 78(2),177-182 (1996), J. Heterocycl. Chem.,
- 20 34(2), 551-556 (1997)、Tetrahedron, 55(52),15067-15070 (1999)、Synthesis, 11,932-933 (1980)に記載の方法又は準じた方法等が挙げられる

又、一般式 [4]、[17]、[18]、[19]、[20]、[21]、[22]、[23]、[24]、[25]、[26]、[29]及び[31]は、 Yがフリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E6a, 16-185 (1994)、Yがチェニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E6a, 186-555(1994)、

PCT/JP02/01015

Yがピロリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E6 a, 556-798(1994)、 Yがピラゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8 b, 399-763(1994)、特開平2000-219679号公報、Yがイソキサゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8a, 45-225 (1993)、Yがイソチアゾリル基の場合は Methoden der Organischen Chemie, E8a, 668-798(1993)、Yがオキサゾリル基の場 合はMethoden der Organischen Chemie, E8a, 891-1019 (1993)、Yがチアゾリル基 の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8 b, 1-398 (1994)、Yがイミダゾリ ル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8 c,1-215(1994)、Yがピリジ ル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E7a, 286-686 (1992)、Yがピリ ダジニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9a, 557-682(1997)、Yが 10 ピリミジニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9 b / 1, 1 -249(1998)、Yがピラジニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie,E9 b/ 1.250-372(1998)、Yがトリアジニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9c, 530-796(1998)、Yがトリアゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8d, 305-405、479-598 (1994)、Yがオキサジアゾリル基の 15 場合はMethoden der Organischen Chemie, E8c, 397-818(1994)、Yがチアジアゾリ ル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8d, 59-304(1994)、Yがベンゾ フリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie,E6b1,33-216(1994)、国際 特許出願公開公報WO-1997/29105号、Yがベンゾチエニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie E6b1,217-322 (1994)、Yがインドリル基の場合はMethoden 20 der Organischen Chemie, E6b1, 546-848 (1994), Methoden der Organischen Chemie, E6b2, 849-1336 (1994)、国際特許出願公開公報WO-1997/42188-A1号、Yが ベンゾオキサゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8a, 1020-1194 (1993)、Yがベンゾチアゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8b. 865-1062 (1994)、Yがベンゾイミダブリル基の場合はMethoden der Or-25

ganischen Chemie, E8c, 216—391 (1994)、Yがベンゾイソキサゾリル基の場合は Methoden der Organischen Chemie, E8a, 226—348 (1993)、Yがベンゾイソチア ゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8a, 799—852 (1993)、Yが インダゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8b, 764—864 (1994)、5 Yがキノリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E7a, 290—570 (1991)、Yがイソキノリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E7a, 571—758 (1991)、Yがフサラジニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9a, 744—789 (1997)、Yがキノキサリニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9b/2, 93—265 (1998)、Yがキナゾリニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9b/2, 1—192 (1998)、Yがシンノリニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9a, 683—743 (1997)、又、Yがベンゾトリアゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9a, 683—743 (1997)、又、Yがベンゾトリアゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8d, 406—478 (1994) 記載の方法又はそれらに準じた方法等で製造することができる。

<製造法2>

15

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は前記と同じ意味を表す。この場合、ピラ ゾール環の炭素原子は、前記と同じ意味の置換基群 α より選択される、 $1\sim 2$ 個の 同一又は相異なる基で置換されていてもよい。)

20 一般式[36]で表される本発明化合物は、製造法1により製造することができる本発明化合物[35]と酸とを溶媒中で反応させることにより、製造することができる。

この反応は通常、反応温度0~120℃で10分~24時間行う。

反応に供される試剤の量は、化合物 [35] 1当量に対して、酸 $1\sim1$ 0 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

酸としては、例えば塩酸、臭化水素酸、トリフルオロ酢酸等が挙げられる。

5 溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、N, Nージメチルアセトアミド、N, Nージメチルホルムアミド又はNーメチルー2ーピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、ギ酸又は酢酸等のカルボン酸類或いは水が挙げられる。

10 <製造法3>

15

$$R^{2}$$
 R^{3} R^{4} R^{6} R^{6} R^{5} R^{5} R^{5} R^{6} $R^{$

(式中、n、 L^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^5 及び R^{10} は前記と同じ意味を表す。 この場合、ピラゾール環の炭素原子は、前記と同じ意味の置換基群 α より選択される、 $1\sim 2$ 個の同一又は相異なる基で置換されていてもよい。)

一般式[37]で表される本発明化合物は、本発明化合物[36]と一般式[3 3]で表される化合物とを溶媒中、塩基存在下に反応させることにより製造することができる。

反応に供される試剤の量は、一般式 [36]で表される化合物1当量に対して、 20 一般式 [33]で表される化合物は1~3当量であり、塩基は、1~3当量である。 溶媒としては、例えばジオキサン又はテトラヒドロフラン (THF)等のエーテル類、ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハ

ロゲン化炭化水素類、N, Nージメチルアセトアミド、N, Nージメチルホルムアミド又はNーメチルー2ーピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、プタノール又はtertーブタノール等のアルコール類、アセトン又は2ーブタノン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、水或いはこれらの混合物が挙げられる。

塩基としては、例えば水素化ナトリウム等の金属水素化物、ナトリウムアミド又はリチウムジイソプロピルアミド等のアルカリ金属アミド類、ピリジン、トリエチルアミン又は1,8-ジアザビシクロ [5.4.0] -7-ウンデセン等の有機塩基 類、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩、或いはナトリウムメトキシド又はカリウムtert -ブトキシド等の金属アルコラート等が挙げられる。

15 <製造法4>

10

15

(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵及びR⁶は前記と同じ意味を表し、R¹は水素又は前記と同じ意味の置換基群 αを表し、X³は塩素原子、フッ素原子、アルキルスルホニル基又は置換されていてもよいベンジルスルホニル基を表し、R¹はアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族へテロ環基、アルコキシカルボニルアルキル基、置換されていてもよいヘテロ環アルキル基、又は置換されていてもよいベンジル基を表し、R¹³はアルキル基、ハロアルキル基、置換されていてもよいベンジル基を表し、R¹³なアルコキシカルボニルアルキル基又は置換されていてもよいベンジル基を表し、R¹¹及びR¹⁵は同一又は異なって、水素原子、アルキル基、置換されていてもよいベンジル基、を表し、R¹¹及びR¹⁵は同一又は異なって、水素原子、アルキル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルホニル基又ルホニル基、置換されていてもよいベンジルカルホニル基、

は置換されていてもよいフェニルスルホニル基を表し、Zは酸素原子、Aオウ原子、N=CR^{11a}、CR^{11a}=N、CR^{11a}=CR^{11b}YはN-R¹⁶を表し、R¹⁶は水素原子又は前記と同じ意味のR¹⁰を表し、R^{11a}、R^{11b}はR¹¹と同じ意味を表す。)

一般式[40]、一般式[42]又は一般式[44]で表される本発明化合物は、

5 一般式[38]で表される本発明化合物とそれぞれ化合物[39]、化合物[41] 又は化合物[43]とを無溶媒又は溶媒中、必要に応じ塩基存在下に反応させることにより製造することができる。

この反応は通常、反応温度20~200℃、好ましくは30~180℃で10分~48時間、必要に応じ加圧下で行う。

10 反応に供される試剤の量は、化合物 [38] 1当量に対して、化合物 [39]、化合物 [41] 又は化合物 [43] は1~20当量である。必要に応じて使用される塩基としては、例えば水酸化カリウム又は水酸化ナトリウム等のアルカリ金属水酸化物、水素化カリウム又は水素化ナトリウム等アルカリ金属水素化物、ナトリウムエトキシド又はナトリウムメトキシド等のアルカリ金属アルコラート、1,8-15 ジアザビシクロ [5.4.0] -7-ウンデセン等の有機塩基が挙げられる。

溶媒としては例えばクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル 又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン又はトルエン等の芳香族炭化水 素類、ヘキサン又はヘプタン等の脂肪族炭化水素類、アセトン又はメチルイソプチ ルケトン等のケトン類、酢酸エチル等のエステル類、Nーメチルピロリドン又はN,

20 N-ジメチルホルムアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等 の硫黄化合物、アセトニトリル或いはそれらの混合物が挙げられる。

<製造法5>

(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁶、Rⁿ及びZは前記と同じ意味を表す。)
 一般式 [46] で表される本発明化合物は、本発明化合物 [45] と酸とを溶媒
 5 中で反応させることにより、製造することができる。

この反応は通常、反応温度0~120℃で10分~24時間行う。

反応に供される試剤の量は、化合物 [45] 1 当量に対して、酸 $1\sim10$ 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

酸及び溶媒としては、製造法2と同様なものが挙げられる。

10 <製造法6>

15

$$R^{2}$$
 R^{3} R^{4} R^{6} R^{9} L^{1} R^{2} R^{3} R^{4} R^{6} R^{1} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5} R^{6} R^{1} R^{2} R^{3} R^{4} R^{6} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5}

(式中、Y、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及び L^1 は前記と同じ意味を表す。 この場合、Yは前記と同じ意味の置換基群 α より選択される、 $1\sim 5$ 個までの同一 又は相異なる基で置換されていてもよい。)

一般式 [48] で表される本発明化合物は、本発明化合物 [47] と化合物 [30] とを溶媒中、塩基存在下に反応させることにより、製造することができる。 この反応は通常、反応温度 0~150℃で10分~24時間行う。 反応に供される試剤の量は、化合物 $\begin{bmatrix} 4 & 7 \end{bmatrix}$ 1 当量に対して、酸 $1 \sim 1$ 2 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

塩基及び溶媒としては、製造法3と同様なものが挙げられる。

<製造法7>

5

10

$$R^{1}$$
 R^{4} R^{6} R^{1} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5} R^{6} R^{1} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5} R^{5}

(式中、Y、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は前記と同じ意味を表し、 R^{17} はアルキル基、置換されていてもよいベンジル基又は置換されていてもよいフェニル基を表す。この場合、Yは前記と同じ意味の置換基群 α より選択される、 $1\sim 5$ 個までの同一又は相異なる基で置換されていてもよい。)

一般式 [50] で表される本発明化合物は、本発明化合物 [49] を水又は水と 混合した溶媒中、塩基存在下又は非存在下に加水分解させることにより、製造する ことができる。

この反応は通常、反応温度0~100℃で10分~24時間行う。

15 反応に供される試剤の量は、化合物 [49] 1 当量に対して、塩基を使用する場合 1~2 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

塩基としては、例えば炭酸カリウム、水素化ナトリウム又は水酸化ナトリウム等の無機塩基、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基が挙げられる。

20 水と混合する溶媒としては、例えばメタノール又はエタノール等のアルコール類、 テトラヒドロフラン等のエーテル類、アセトン又はメチルイソプチルケトン等のケトン類、N,N-ジメチルホルムアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド又は

スルホラン等の硫黄化合物、アセトニトリル或いはそれらの混合物が挙げられる。 <製造法8>

5 (式中、Y、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及び R^8 は前記と同じ意味を表し、 R^{18} は アルキル基を表す。この場合、Yは前記と同じ意味の置換基群 α より選択される、 $1\sim5$ 個までの同一又は相異なる基で置換されていてもよい。)

一般式[53]で表される本発明化合物は、本発明化合物[51]と化合物[52]とを溶媒中、塩基存在下に反応させることにより、製造することができる。

10 この反応は通常、反応温度0~100℃で10分~24時間行う。

反応に供される試剤の量は、化合物 [51] 1 当量に対して、化合物 [52] の 塩酸塩又は硫酸塩 $1\sim5$ 当量、塩基 $1\sim1$ 0 当量が望ましいが、反応の状況に応じ て任意に変化させることができる。

塩基としては、例えば炭酸カリウム又は炭酸ナトリウム等の金属炭酸塩類、酢酸 カリウム又は酢酸ナトリウム等の金属酢酸塩類、トリエチルアミン、ジメチルアミン又は1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基が挙げられる。

溶媒としては、例えばメタノール、エタノール等のアルコール類、テトラヒドロフラン等のエーテル類、N,Nージメチルホルムアミド等のアミド類、水或いはそれらの混合物が挙げられる。

<製造法9>

20

10

(式中、Y、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は前記と同じ意味を表し、 R^{19} 及び R^{20} は、各々、水素原子又はアルキル基を表す。この場合、Yは前記と同じ意味の置換基群 α より選択される、 $1\sim 5$ 個までの同一又は相異なる基で置換されていてもよい。)

一般式[57]で表される本発明化合物は、本発明化合物[50]と塩化チオニル[54]とを溶媒中又は無溶媒中で反応させて化合物[55]を製造した後、化合物[55]と化合物[56]とを溶媒中又は無溶媒中で反応させることにより、製造することができる。

[50]から[55]の反応は、通常、反応温度0~100℃で10分~24時間行う。

反応に供される試剤の量は、化合物 [50] 1当量に対して、塩化チオニル [54] 1~100当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることがで きる。

溶媒としては例えばジクロロメタン又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素 類、ジエチルエーテル又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン又はトル エン等の芳香族炭化水素類が挙げられる。

[55]から[57]の反応は、通常、反応温度0~100℃で10分~24時間行う。

反応に供される試剤の量は、化合物 [55] 1当量に対して、化合物 [56] は 1~100当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。 溶媒としては例えば [50] から [55] の反応と同様なものが挙げられる。 <製造法10>

10(式中、Z、R¹、R²、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹¹及びX³は前記と同じ意味を表す。)一般式[59]で表される本発明化合物は、本発明化合物[38]と化合物[58]とを溶媒中で反応させることにより、製造することができる。

この反応は通常、反応温度0~100℃で10分~24時間行う。

反応に供される試剤の量は、化合物 [38] 1当量に対して、化合物 [58] は 1~2当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

溶媒としては、例えばジオキサン又はテトラヒドロフラン(THF)等のエーテル類、ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、N,Nージメチルアセトアミド、N,Nージメチルホルムアミド又はNーメチルー2ーピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、アセトン又は2ーブタノン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、水或いはこれらの混合物が挙げられる。

<製造法11>

15

20

·20

$$R^{2}$$
 R^{3} R^{4} R^{6} R^{21} -OH R^{2} R^{2} R^{4} R^{6} R^{2} R^{4} R^{6} R^{2}

(式中、Y、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は前記と同じ意味を表し、 R^{21} はアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、置換されていてもよいヘテロアルキル基、又は置換されていてもよいベンジル基を表す。この場合、Yは前記と同じ意味の置換基群 α より選択される、 $1\sim5$ 個までの同一又は相異なる基で置換されていてもよい。)

一般式 [61] で表される本発明化合物は、本発明化合物 [47] と化合物 [6 10 0] とをアゾ化合物とトリフェニルホスフィンの存在下、溶媒中で反応させる公知 の方法 (Synthesis, 1-28(1981)) に準じて製造することができる。

この反応は通常、反応温度0~100℃で10分~24時間行う。

反応に供される試剤の量は、化合物 [47] 1当量に対して、化合物 [60] 1 ~1.5当量、アゾ化合物 1~1.5当量、トリフェニルホスフィン1~1.5当量 が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

溶媒としては、例えばジオキサン又はテトラヒドロフラン(THF)等のエーテル類、ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、N,Nージメチルアセトアミド、N,Nージメチルホルムアミド又はNーメチルー2ーピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル或いはこれらの混合物等が挙げられる。

アゾ化合物としては、例えばアゾジカルボン酸ジエチル又はアゾジカルボン酸ジ

イソプロピル等が挙げられる。

<製造法12>

5 (式中、 X^3 、n、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及びZは前記と同じ意味を表し、mは $1\sim4$ の整数を表す。この場合、ピラゾール環の3位の炭素原子は、前記と同じ意味の置換基群 α より選択される基で置換されていてもよい。)

一般式 [63]で表される本発明化合物は、本発明化合物 [62] を塩基存在下 溶媒中で反応させることにより、製造することができる。

10 この反応は通常、反応温度0~120℃で10分~24時間行う。

反応に供される試剤の量は、一般式 [62]で表される化合物1当量に対して、 塩基1~3当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。 塩基及び溶媒としては、製造法3と同様なものが挙げられる。

尚、製造法2及び製造法4~11記載のスルフィド化合物は、製造法1記載の方法で酸化することによりスルホキシド体及びスルホン化合物を製造することができる。更に、製造法2及び製造法4~11に記載されたスルフィド化合物の置換基YがC1~C10アルキルチオ基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルチオ基又はC1~C4ハロアルキルチオ基で置換されている場合、製造法1記載の方法に準じて、前記スルフィド化合物に対して等量から過剰の酸化剤を加えることにより、置換基Y上の置換基(C1~C10アルキルチオ基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルチオ基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルチオ基又はC1~C4ハロアルキルチオ基)も同時に酸化され、これらの置換基のスルホキシド体及びスルホン化合物を製造することができる。

次に、実施例をあげて本発明化合物の製造法、製剤法及び用途を具体的に説明する。尚、本発明化合物の製造中間体の製造法も併せて記載する。

<実施例1>

3-(5-クロロー1-フェニルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾール5 -4-イルメチルチオ) -5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0001)の製造

5,5ージメチル-3ーメチルスルホニルー2ーイソオキサゾリン2.3g(13.1ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド20m1溶液に、水硫化ナトリウム水和物2.1g(純度70%、26.2ミリモル)を加え2時間攪拌した。その後、無水10 炭酸カリウム1.8g(13.1ミリモル)、ロンガリット2.0g(13.1ミリモル)及び4ーブロモメチルー5ークロロー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾール3.6g(10.5ミリモル)を加え、更に室温で15時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、白色結晶(融点89~90℃)の3ー(5ークロロー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリン2.7g(収率65.5%)を得た。

 1 H-NMR (CDCl₃/TMS, δ (ppm)) : 7.55-7.50(5H, m), 4.33(2H, s), 2.83(2H, s),

20 1.45 (6H, s)

<実施例2>

3-(5-クロロー1-フェニルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾール -4-イルメチルスルホニル) -5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン(本発 明化合物番号3-0002)の製造

25 3-(5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール

-4-イルメチルチオ).-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.4g(1.0ミリモル)のクロロホルム15ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸0.63g(純度70%、2.6ミリモル)を加え、室温で22時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、白色結晶(融点132~133℃)の3-(5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.4g(収率83.2%)を得た。

10 1 H-NMR (CDC1₃/TMS, δ (ppm)): 7.60-7.51(5H, m), 4.73(2H, s), 3.14(2H, s), 1.53(6H, s)

<実施例3>

15

20

3ー(5ークロロー1ーメチルー3ーフェニルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ) ー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリン0.85g(2.53ミリモル)のクロロホルム30m I 溶液に、氷冷下、mークロロ過安息香酸0.87g(純度70%、3.54ミリモル)を加え、室温で1時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、透明アメ状物質の3ー(5ークロロー1ーメチルー3ーフェニルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルス

25 ルフィニル) -5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.48g (収率53.

9%)を得た。

10

25

 1 H-NMR (CDC1 $_{3}$ /TMS, δ (ppm)): 7.63-7.60 (2H, m), 7.48-7.37 (3H, m), 4.29 (2H, q), 3.91(3H, s), 3.12(1H, d), 2.79(1H, d), 1.41(3H, s), 1.35(3H, s) <実施例4>

5,5-ジメチル-3-(5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチ 5 ルー1H-ピラゾールー4-イルメチルチオ)- 2-イソオキサゾリン(本発明化 合物番号3-0021)の製造

5,5-ジメチルー3-メチルスルホニルー2-イソオキサゾリン(本発明化合 物番号2-1) 18.7g(105.7ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド3 00m1溶液に、水硫化ナトリウム水和物9.3g(純度70%、116.3ミリモ ル)を加え2時間攪拌した。反応系を氷冷し、4-ブロモメチルー5-フルオロー 1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール30.3g(93.8ミ リモル)のN, Nージメチルホルムアミド200m1溶液を加え、更に0℃で30分 間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた 有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留 15 去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: ヘキサンー酢酸エ チル混合溶媒)で精製し、黄色油状物質の5,5ージメチルー3ー(5ーフルオロー 1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチ オ) -2-イソオキサゾリン13.11g(収率37.4%)を得た。

(1 H-NMR値 (CDC1,/TMS δ (ppm)) : 7.65-7.39(5H, m), 4.24(2H, s), 2.81(2H, s), 20 1.43(6H, s)

<実施例5>

5.5-ジメチルー3ー(5-エチルチオー1-フェニルー3ートリフルオロメ チルー1H-ピラゾールー4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン(本発明 化合物番号3-0022)の製造

エタンチオール 0.2 5 g (4.0 ミリモル)の N, N ージメチルホルムアミド10 m 1 溶液に、水酸化ナトリウム 0.2 g (4.0 ミリモル)、水 1 m 1 を加え、室温で30分間攪拌した。5,5ージメチルー3ー(5ーフルオロー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1 Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー2ーイソオキサゾリン 0.5 g (1.4 ミリモル)の N, N ージメチルホルムアミド 5 m 1 溶液を加え、更に 1 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、5,5ージメチルー3ー(5ーエチルチオー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1 Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー2ーイソオキサゾリン 0.6 g (収率100%)を得た。

(1 H-NMR値 (CDC1 $_{3}$ /TMS δ (ppm)) : 7.62-7.47(5H, m), 4.44(2H, s), 2.83(2H, s), 2.50(2H, q), 1.45(6H, s), 1.02(3H, t)

<実施例6>

5,5-ジメチルー3-(5-エチルスルホニル-1-フェニル-3-トリフル 15 オロメチルー1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾ リン(本発明化合物番号3-0004)の製造

5,5ージメチルー3ー(5ーエチルチオー1ーフェニルー3ートリフルオロメ チルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ) ー2ーイソオキサゾリン0.6g (1.3ミリモル)のクロロホルム10m1溶液に、氷冷下、mークロロ過安息香酸 20 1.7g(純度70%、6.7ミリモル)を加え、室温で16時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、淡黄色結晶(融点158~160℃)の5,5ージメチルー3ー(5ーエチル スルホニルー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ー イルメチルスルホニル)-2 - イソオキサゾリン 0.6 g(収率 9 3.0 %)を得た。 (1 H-NMR値(CDC1 $_3$ /TMS δ (ppm)): 7.58-7.54(5H, m), 5.16(2H, s), 3.18(2H, s), 3.15(2H, q), 1.55(6H, s), 1.24(3H, t)

<実施例7>

5 5,5ージメチルー3ー(5ージメチルアミノー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー2ーイソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0023)の製造

5,5ージメチルー3ー(5ーフルオロー1ーフェニルー3ートリフルオロメ チルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ) ー2ーイソオキサゾリン0.5g
10 (1.3ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド10ml溶液に、ジメチルアミン40%水溶液0.8g(6.7ミリモル)を加え、封管で100℃で9時間攪拌した。ジメチルアミン40%水溶液3.0g(26.6ミリモル)を加え、更に9時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、5,5ージメチルー3ー(5ージメチルアミノー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー2ーイソオキサゾリン0.4g(収率80.6%)を得た。

(1 H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 7.58-7.38(5H, m), 4.35(2H, s), 2.82(2H, s), 2.77(6H, s), 1.45(6H, s)

<実施例8>

20

5,5-ジメチル-3-(5-ジメチルアミノ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル) -2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0005)の製造

25 5、5-ジメチルー3-(5-ジメチルアミノ-1-フェニルー3-トリフルオ

ロメチルー1 Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ) -2ーイソオキサゾリン0. 4g(1.1ミリモル)のクロロホルム10ml溶液に、氷冷下、mークロロ過安息香酸0.7g(純度70%、2.7ミリモル)を加え、室温で20時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸 水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点150~151℃)の5,5ージメチルー3ー(5ージメチルアミノー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルスルホニル)ー2ーイソオキサゾリン0.2g(収率52.0%)を得た。 (『H-NMR値(CDC1。/TMS δ(ppm)):7.61-7.38(5H, m), 4.75(2H, s), 3.13(2H, s), 2.76(6H, s), 1.53(6H, s)

<実施例9>

15

3-(1-t-プチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサプリン (本発明化合物番号3-0006) の製造

5,5ージメチルー3ーメチルスルホニルー2ーイソオキサゾリン24.1g(136.0ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド200m1溶液に、水硫化ナトリウム21.8g(純度70%、272.5ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、無水炭酸カリウム18.8g(136.2ミリモル),ロンガリット21.0g(136.

20 2ミリモル)を加え、更に2時間攪拌後、4ープロモメチルー1ーtertープチルー 5ークロロー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾール40g(125ミリモル)を氷冷下加えた。その後、室温で2時間攪拌し、反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、淡桃色結

晶(融点 $79.0\sim81.0$ °C)の3-(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチルー<math>1H-ピラゾールー4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン23.0g(収率57.1%)を得た。

('H-NMR値(CDCl₃/TMS δ (ppm)): 4.24(2H, s), 2.80(2H, s), 1.71(9H, s), 1.43(6H, s)

<実施例10>

<実施例11>

- 10 3-(1-t-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン19.8 g (53.4ミリモル)を25%臭化水素-酢酸溶液170m1に加え、40~50℃で,2時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。15 減圧下溶媒を留去し、淡黄色結晶(融点120.0~122.0℃)の3-(5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン12.0 g (収率60.6%)を得た。 ('H-NMR値 (CDC1√TMS δ (ppm)): 4.26(2H, s),2.81(2H, s),1.44(6H, s)
- 20 3-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサプリン(本発明化合物番号3-0008)及び3-(3-クロロ-1-ジフルオロメチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサプリン(本発明化合物番号3-0009)の製造
- 25 3-(5-クロロー3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールー4ーイルメチ

 $3-(5-\rho \mu \mu -1-\psi)$ フルオロメチルー3-トリフルオロメチルー1 Hーピ ラゾールー4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン (1 H-NMR値 (CDC1 $_3$ /TMS δ (ppm)): 7. 22(1H, t), 4. 25(2H, s), 2. 80(2H, s), . 44(6H, s)

<実施例12>

20

25

3-(5-クロロー1ージフルオロメチルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリン0.6 9g(1.9ミリモル)のクロロホルム20ml溶液に、氷冷下、mークロロ過安息香酸1.4g(純度70%,8.1ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた固体をnーヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点126.0~127.0℃)の3-(5-クロロー1ージフルオロメチルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルスルホニル)ー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリン0.4g(収率53.3%)を得た。

('H-NMR値 (CDC1₃/TMS δ (ppm)): 7.26(1H, t), 4.68(2H, s), 3.11(2H, s), 1.53(6H, s)

<実施例13>

10

15 3-(3-クロロー1-ジフルオロメチル-5-トリフルオロメチルー1H-ピ ラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリ ン (本発明化合物番号3-0011)の製造

3-(3-クロロー1ージフルオロメチルー5ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリン0.5
20 4g(1.5ミリモル)のクロロホルム20m1溶液に、氷冷下、mークロロ過安息香酸1.1g(純度70%,6.4ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶25 媒を留去し、得られた固体をnーへキサンで洗浄し、白色粉末(融点136.0~1

37.0℃)の3-(3-クロロ-1-ジフルオロメチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル<math>)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.47g(収率79.7%)を得た。

(H-NMR値 (CDC1₃/TMS δ (ppm)): 7. 23(1H, t), 4. 71(2H, s), 3. 11(2H, s), 1. 53(6H,

く実施例14>

5 s)

WO 02/062770

5,5ージメチルー3ー(3ーメトキシー1ーメチルー5ートリフルオロメチル ー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー2ーイソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0024)の製造

10 5,5ージメチルー3ーエチルスルホニルー2ーイソオキサゾリン3.3g(17.3ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド10ml溶液に、水硫化ナトリウム水和物3.1g(純度70%、22.0ミリモル)を加え2時間攪拌した。その後、無水炭酸カリウム3.1g(22.0ミリモル)、ロンガリット2.7g(17.5ミリモル)及び4ークロロメチルー3ーメトキシー1ーメチルー5ートリフルオロメチルー15 1Hーピラゾール4.0g(17.5ミリモル)を加え、更に室温で2時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、5,5ージメチルー3ー(3ーメトキシー1ーメチルー5ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー2ーイソオキサゾリン2.8g(収率52.0%)を得た。

<実施例15>

25

5,5-ジメチル-3-(3-ヒドロキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン (本発明化合物番号3-0025) の製造

25%臭化水素酸酢酸溶液 20m1に5,5ージメチルー3ー(3ーメトキシー1ーメチルー5ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー2ーイソオキサゾリン3.3g(10.6ミリモル)を加え、50℃で3時間攪拌した。反応終了後、反応溶液減圧下溶媒を留去し、得られた残渣を水中に注いだ。 析出した結晶を濾取し水洗後乾燥し、目的とする5,5ージメチルー3ー(3ーヒドロキシー1ーメチルー5ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー2ーイソオキサゾリン3.1g(収率96.0%)を得た。

<実施例16>

5,5-ジメチル-3-(3-エトキシー1-メチルー5ートリフルオロメチル
 10 -1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0026)の製造

5,5-ジメチルー3ー(3ーヒドロキシー1ーメチルー5ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ) -2ーイソオキサゾリン0.30g (1.0ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド10ml溶液に無水炭酸カリウ 40.20g(1.3ミリモル)及びヨウ化エチル0.20g(1.5ミリモル)を加え、50℃で3時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、目的とする5,5ージメチルー3ー(3ーエトキシー1ーメチルー5ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ) -2ーイ ソオキサゾリン0.30g(収率92.0%)を得た。

<実施例17>

5,5-ジメチル-3-(3-エトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル -1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン(本発 明化合物番号3-0012)の製造

5.5 - 5.5 - 5

-1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ) -2ーイソオキサゾリン0.30 g (0.92ミリモル)のクロロホルム10m1溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香 酸0.68g(純度70%、2.76ミリモル)を加え、室温で5時間攪拌した。反応 終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸 水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、 無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサン で洗浄し、白色結晶 (融点124~125℃) の5.5 – ジメチルー3ー(3-エト キシー1-メチルー5-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4-イルメチ ルスルホニル)-2-イソオキサゾリン0.24g(収率73.0%)を得た。

10 (1 H-NMR値(CDC1₂/TMS δ (ppm)) : 4.50(2H, s), 4.27(2H, q), 3.86(3H, s), 3. 04 (2H, s), 1. 49 (6H, s), 1. 39 (3H, t)

<実施例18>

5

15

5.5ージメチルー3ー(5ーフルオロー1ーメチルー3ートリフルオロメチル -1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン (本発明化合 物番号3-0027)の製造

20.3ミリモル)のN, N-ジメチルホルムアミド200m1溶液に、水硫化ナト リウム19.3g(純度70%、344.6ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、 無水炭酸カリウム16.7g(121.0ミリモル), ロンガリット18.6g(120. 7ミリモル)を加え、更に2時間攪拌後、4ーブロモメチルー5ーフルオロー1ー 20 メチルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾール31.4g(120.3ミリ モル)を氷冷下加えた。その後、室温で2時間攪拌し、反応終了確認後、反応溶液 を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、 無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、黄色油状物の5,5-ジ 25メチルー3-(5-フルオロー1-メチルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラ

ゾールー4ーイルメチルチオ) -2ーイソオキサプリン29.0g (収率90.3%) を得た。

(1 H-NMR値 (CDCl $_{3}$ /TMS δ (ppm)): 4.24(2H, s), 3.90(3H, s), 2.78(2H, s), 1.42(6H, s)

5 < 実施例 19>

5,5-ジメチル-3-(5-メトキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル -1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン (本発明化合物番号3-0028) の製造

5,5-ジメチルー3ー(5-フルオロー1ーメチルー3ートリフルオロメチル
10 ー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー2ーイソオキサゾリン0.5g(1.6ミリモル)のメタノール20ml溶液に、ナトリウムメトキシド0.77g(4.0ミリモル,28%メタノール溶液)を加え、還流下、4時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、黄色油状物の5,5-ジメチルー3ー(5-メトキシー1-メチルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー2ーイソオキサゾリン0.5g(収率96.7%)を得た。

(1 H-NMR値 (CDC1 $_{3}$ /TMS δ (ppm)) :4.26(2H, s), 4.07(3H, s), 3.72(3H, s), 2.80(2H, s), 1.43(6H, s)

20 < 実施例 2 0 >

5,5-ジメチル-3-(5-メトキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル -1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)2-イソオキサゾリン(本発明 化合物番号3-0013)の製造

5,5ージメチルー3ー(5ーメトキシー1ーメチルー3ートリフルオロメチル 25 ー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー2ーイソオキサプリン0.5 g(1.

5ミリモル)のクロロホルム20ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1. 3g (純度70%, 7.5ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた固体をn-ヘキサンで洗浄し,白色粉末(融点 $113.0\sim114.0^{\circ}$)の5,5-ジメチル-3-(5-メトキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン0.31g (収率58.2%)を得た。

10 (1 H-NMR値 (CDC1 $_3$ /TMS δ (ppm)) : 4.60(2H, s), 4.11(3H, s), 3.79(3H, s), 3.10(2H, s), 1.51(6H, s)

<実施例21>

15 ン(本発明化合物番号3-0029)の製造

2-クロロフェノール0.44g(3.4ミリモル)のN, Nージメチルホルムアミド30m1溶液に、水素化ナトリウム0.2g(8.3ミリモル, 純度60%)を氷冷下で加え、1時間攪拌した後、更に5,5ージメチルー3ー(5ーフルオロー1ーメチルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー2ーインオキサゾリン0.7g(2.2ミリモル)を加え、120~130℃で5時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色油状物の3ー(5ー(2ークロロフェノキシ)ー1ーメチルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー5、

5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.63g(収率66.7%)を得た。 <実施例22>

3-(5-(2-クロロフェノキシ)-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1 H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.63g(1.5ミリモル)のクロロホルム20m1溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1.0g(純度70%,5.8ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、

10 更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた固体をnーヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点67.0~70.0℃)の3-(5-(2-クロロフェノキシ)-1-メチル-3-トリフルオロ

15 メチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルスルホニル)ー5,5ージメチルー2 ーイソオキサゾリン0.31g(収率45.7%)を得た。

(1 H-NMR値(CDCl₃/TMS δ (ppm)): 7.50-6.91(4H, m), 4.45(2H, s), 3.71(3H, s), 3.03(2H, s), 1.47(6H, s)

<実施例23>

25

20 3-(5-シクロペンチルオキシー1-メチルー3-トリフルオロメチルー1H -ピラゾールー4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン (本発明化合物番号3-0030)の製造

トリフェニルホスフィン $0.43g(1.6 \le y \le w)$ のベンゼン10m1溶液に シクロペンタノール $0.14g(1.6 \le y \le w)$, 5,5-ジメチル-3-(5-ヒドロキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメ チルチオ) -2-イソオキサゾリン0.5 g(1.6ミリモル),及びアゾジカルボン酸ジエチルエステル 0.7 g(40%トルエン溶液, 1.6ミリモル)を加え、室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色透明油状物の3-(5-シクロペンチルオキシー1-メチルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン0.52g(収率85.2%)を得た。

10 < 実施例 2 4 >

3-(5-シクロペンチルオキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサ ゾリン(本発明化合物番号3-0015)の製造

3-(5-シクロペンチルオキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H
-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン
0.52g(1.4ミリモル)のクロロホルム20ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過
安息香酸0.85g(純度70%,4.9ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、
更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルム
で抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム
れ溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧
下溶媒を留去し、得られた固体をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点113.0~114.0℃)の3-(5-シクロペンチルオキシ-1-メチル-3-トリフル
オロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル
-2-イソオキサゾリン0.2g(収率35.5%)を得た。

25 (H-NMR値 (CDC1₃/TMS δ (ppm)): 5.03 (1H, br), 4.60 (2H, s), 3.73 (3H, s), 3.05 (2H,

s), 1.88-1.70(8H, m), 1.50(6H, s)

<実施例25>

3-(5-シアノー1-メチルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー 4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン(本発明化合物番 5 号3-0031)の製造

5,5ージメチルー3ー(5ーフルオロー1ーメチルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー2ーイソオキサゾリン0.5g(1.6ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド3.0ml溶液にシアン化ナトリウム0.2g(4.0ミリモル)を加え、40℃で1時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、黄色油状物の3ー(5ーシアノー1ーメチルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリンの粗化合物0.9gを得た。(¹H-NMR値(CDC1₃/TMS δ(ppm)):4.30(2H,s),4.08(3H,s),2.81(2H,s),1.43(6H,

<実施例26>

15

s)

3-(5-シアノ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールー4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0016)の製造

3-(5-シアノ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールー4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.9g(粗化合物)のクロロホルム50m1溶液に、氷冷下、mークロロ過安息香酸2.1g(純度70%,12.2ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩

水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた固体をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点 $105.0\sim108.0$)の3-(5-シアノ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.43g(収率76.4%)を得た。

(1 H-NMR値(CDCl₃/TMS δ (ppm)): 4.73(2H, s), 4.16(3H, s), 3.14(2H, s), 1.53(6H, s)

<実施例27>

3-(3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ) 10 -5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0032)の 製造

5,5ージメチルー3ーエチルスルホニルー2ーイソオキサゾリン0.7g(3.7ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド30m1溶液に、水硫化ナトリウム0.6g(純度70%、10.7ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、無水炭酸カリウム0.51g(3.7ミリモル),ロンガリット0.56g(3.6ミリモル)を加え、更に2時間攪拌後、4ーブロモメチルー3,5ージクロロー1ーエチルー1Hーピラゾール0.9g(3.5ミリモル)を氷冷下加えた。その後、室温で2時間攪拌し、反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、20 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色透明油状物の3ー(3,5ージクロロー1ーエチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリン0.8g(収率70.8%)を得た。

(1 H-NMR値(CDCl $_3$ /TMS δ (ppm)): 4.14(2H, s), 4.14(2H, q), 2.81(2H, s), 1.43(6H, 25 s), 1.42(3H, t)

<実施例28>

3-(3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスル ホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサプリン (本発明化合物番号<math>3-0017) の製造

- 3-(3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾールー4-イルメチルチオ) -5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン0.8g (2.6ミリモル)のクロロホルム20ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸2.0g (純度70%,11.6ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫10酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた固体をnーヘキサンで洗浄し,白色粉末(融点105.0~107.0℃)の3-(3,5-ジクロロ-1-エチルー1H-ピラゾールー4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン0.41g(収率46.6%)を得た。
- 15 (H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 4.48(2H, s), 4.19(2H, q), 3.05(2H, s), 1.51(6H, s), 1.45(3H, t)

<実施例29>

20

25

3-(5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4 -イルメチルチオ) -5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン (本発明化合物番号3-0020) の製造

5,5ージメチルー3ーエチルスルホニルー2ーイソオキサゾリン1.9g(10.0ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド30ml溶液に、水硫化ナトリウム水和物1.2g(純度70%、15.0ミリモル)を加え2時間攪拌した。その後、無水炭酸カリウム2.1g(15.0ミリモル)、ロンガリット2.3g(15.0ミリモル)及び4ープロモメチルー5ークロロー3ージフルオロメチルー1ーメチルー1H

ーピラゾール2.6g(10.0ミリモル)を加え、更に室温で15時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)

(1 H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) :6.70(1H, t, J=54.2Hz), 4.24(2H, s), 3.86(3H, s), 2.80(2H, s), 1.42(6H, s)

10 <実施例30>

25

 $3-(5-\rho pp-3-i y z p$

3ー(5ークロロー3ージフルオロメチルー1ーメチルー1Hーピラゾールー4 ーイルメチルチオ) ー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリン1.8g(5.8ミリモル)のクロロホルム15m1溶液に、氷冷下、mークロロ過安息香酸3.6g(純度70%、14.5ミリモル)を加え、室温で22時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、白色結晶(融点78~79℃)の3ー(5ークロロー3ージフルオロメチルー1ーメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメチルスルホニル) ー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリン1.7g(収率85.9%)を得た。

(1 H-NMR値 (CDCl $_{3}$ /TMS δ (ppm)) 6.80 (1H, t, J=54.8Hz), 4.60 (2H, s), 3.91 (3H, s), 3.08 (2H, s), 1.51 (6H, s)

<実施例31>

5,5-ジメチル-3-(5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール -4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号4-000 3)の製造

- 5、5ージメチルー3ーメチルスルホニルー2ーイソオキサゾリン0.4g(2.3ミリモル)のN、Nージメチルホルムアミド10ml溶液に、水硫化ナトリウム水和物0.4g(純度70%、4.6ミリモル)を加え2時間攪拌した。その後、炭酸カリウム0.3g(2.3ミリモル)、ロンガリット0.4g(2.3ミリモル)及び4ープロモメチルー5ーメチルー3ートリフルオロメチルイソキサゾール0.5g(1.
- 10 8ミリモル)を加え、更に室温で14時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、5,5ージメチルー3ー(5ーメチルー3ートリフルオロメチルイソキサゾールー4ーイルメチルチオ)-2ーイソオキサゾリン0.4g(収率70.0%)を得た。

(1 H-NMR値(CDC1 $_3$ /TMS δ (ppm)):4.11(2H, s), 2.77(2H, s), 2.54(3H, s), 1.42(6H, s)

<実施例32>

25

5,5ージメチルー3ー(5ーメチルー3ートリフルオロメチルイソキサゾール
 20 ー4ーイルメチルスルホニル)ー2ーイソオキサゾリン(本発明化合物番号4-0
 001)の製造

5,5-ジメチルー3-(5-メチルー3-トリフルオロメチルイソキサゾール -4-イルメチルチオ) -2-イソオキサゾリン0.4g(1.3ミリモル)のクロロホルム10m1溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸0.8g(純度70%、3.2ミリモル)を加え、室温で4時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ クロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、白色結晶(融点13 $5\sim136\%$)の5,5-ジメチル-3-(5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン0.4g(収率95.0%)を得た。

(1 H-NMR値(CDCl $_{3}$ /TMS δ (ppm)): 4.54(2H, s), 3.11(2H, s), 2.61(3H, s), 1.52(6H, s)

<実施例33>

10 [(5-クロロー3-メチルーイソチアゾールー4-イル)ーメチルチオ]ー5,5
ージメチルー2ーイソオキサゾリン (本発明化合物番号4-0004) の製造
5,5ージメチルー3ーメチルスルホニルー2ーイソオキサゾリン0.89g(5.00ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド10m1溶液に、室温で水硫化ナトリウム0.82g(純度70%,10.00ミリモル)を加え2時間攪拌した。その後
15 反応溶液中に無水炭酸カリウム0.70g(5.00ミリモル)、ロンガリット0.78g(5.00ミリモル)及び5ークロロー4ークロロメチルー3ーメチルイソチアゾール0.91g(5.00ミリモル)を加え、更に室温で一夜攪拌した。反応終了確認後、水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカグルカラムクロマトグラフィーで精製し、[(5ークロロー3ーメチルーイソチアゾールー4ーイル)ーメチルチオ]ー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリン1.38g(収率:定量的)を得た。

<実施例34>

[(5-クロロ-3-メチルーイソチアゾールー4ーイル)ーメチルスルホニル]25 -5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号4-0002)の

製造

[(5-クロロー3-メチルーイソチアゾールー4-イル)ーメチルチオ]ー5,5 ージメチルー2ーイソオキサゾリン1.38g(5.00ミリモル)のクロロホルム 20m1溶液に、mークロロ過安息香酸2.96g(純度70%,12.00ミリモ ル)を氷冷下で加え、1時間攪拌し、更に室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応 溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウ ム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグ ネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラ フィーで精製し、淡黄色粉末(融点113~114℃)の[(5-クロロー3-メチ ルーイソチアゾールー4-イル)ーメチルスルホニル]ー5,5ージメチルー2ーイ ソオキサプリン0.65g(収率47.0%)を得た。

(1 H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) 8.89(1H,s), 4.67(2H,s), 3.05(2H,s), 2.59(3H,s), 1.51(6H,s)

<実施例35>

20

25

5,5-ジメチル-3-[2,5-ジメチルー4-(1-メトキシイミノエチル)ーチオフェン-3-イルメチルチオ]-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号2 -0002)の製造

3-(4-アセチルー2,5-ジメチルチオフェンー3-イルメチルチオ)-5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン1.0g(3.4ミリモル)のエタノール50m1溶液にO-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩0.57g(6.8ミリモル)と酢酸ナトリウム0.56g(6.8ミリモル)を加え、還流下,5時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色油状物の5,5-ジメチルー3-[2,5-ジメチルー4-(1-

メトキシイミノエチル) - チオフェン- 3 - イルメチルチオ] - 2 - イソオキサゾリン 0. 4 g (3 6, 4%) を得た。

(1 H-NMR値(CDCl₃/TMS δ (ppm)): 4.21(2H, s), 3.95(3H, s), 2.76(2H, s), 2.38(3H, s), 2.34(3H, s), 2.13(3H, s), 1.42(6H, s)

5 < 実施例 3 6 >

5,5-ジメチル-3-[2,5-ジメチル-4-(1-メトキシイミノエチル)- チオフェン-3-イルメチルスルホニル]-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号2-0001)の製造

5,5ージメチルー3ー[2,5ージメチルー4ー(1ーメトキシイミノエチル)ー

チオフェンー3ーイルメチルチオ]ー2ーイソオキサゾリン0.4g(1.2ミリモル)のクロロホルム30ml溶液に、mークロロ過安息香酸0.61g(純度70%,3.5ミリモル)を氷冷下で加え1時間攪拌し、更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、白色結晶(融点95.0~96.0℃)の5,5ージメチルー3ー[2,5ージメチルー4ー(1ーメトキシイミノエチル)ーチオフェンー3ーイルメチルスルホニル]ー2ーイソオキサゾリン0.35g(80%)を得た。

20 (1 H-NMR値 (CDC1 $_{3}$ /TMS δ (ppm)): 4.79(2H, s), 3.95(3H, s), 2.93(2H, s), 2.42(3H, s), 2.37(3H, s), 2.17(3H, s), 1.47(6H, s)

<実施例37>

5,5-ジメチル-3-(4-トリフルオロメチルーピリジン-3-イルメチル チオ)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号7-0003)の製造

6ミリモル)のN, Nージメチルホルムアミド20m1溶液に、水硫化ナトリウム0.26g(純度70%、4.6ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、無水炭酸カリウム0.22g(1.6ミリモル),ロンガリット0.25g(1.6ミリモル)を加え、更に2時間攪拌後、3ープロモメチルー4ートリフルオロメチルーピリジン0.3 g(1.3ミリモル)を氷冷下加えた。その後、室温で2時間攪拌し、反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色油状物の5,5ージメチルー3ー(4ートリフルオロメチルーピリジンー3ーイルメチルチオ)ー2ーイソオキサゾリン 0.45g(収率98.9%)を得た。(H-NMR値(CDC1₃/TMS δ(ppm)):8.98(1H,s),8.70(1H,d),7.51(1H,d),4.47(2H,s),2.79(2H,s),1.43(6H,s)

<実施例38>

5,5-ジメチル-3-(4-トリフルオロメチルーピリジン-3-イルメチル 15 スルホニル)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号7-0001) および 5,5-ジメチル-3-(4-トリフルオロメチルーピリジン-N-オキシド-3 -イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号7-000 2) の製造

5,5ージメチルー3ー(4ートリフルオロメチルーピリジンー3ーイルメチル
20 チオ)ー2ーイソオキサゾリン 0.45g(1.6ミリモル)のクロロホルム20ml溶液に、氷冷下、mークロロ過安息香酸0.77g(純度70%,4.5ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無25 水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムク

ロマトグラフィー (展開溶媒: ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒) で精製し、淡黄色結晶 (融点 $7.0 \sim 80.0 \sim 0.0 \sim 0.5$, 5-ジメチル-3-(4-トリフルオロメチルーピリジン-3-イルメチルスルホニル) <math>-2-4 ソオキサグリン $0.06 \sim 0.0 \sim 0.00 \sim 0.$

(1 H-NMR値(CDCl₃/TMS δ (ppm)): 8.98(1H, s), 8.84(1H, d), 7.64(1H, d), 4.92(2H,

5,5-ジメチル-3-(4-トリフルオロメチルーピリジン-N-オキシド-3-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン

(1 H-NMR値 (CDC1 $_{3}$ /TMS δ (ppm)) : 8.50(1H, s), 8.25(1H, d), 7.59(1H, d), 4.81(2H, s), 3.12(2H, s), 1.53(6H, s)

15 <実施例39>

s), 3.09(2H, s), 1.52(6H, s)

10

5,5ージメチルー[(4ーメトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンー5ーイル)ーメチルチオ]ー2ーイソオキサプリン(本発明化合物番号8-0002)の製造

5,5-ジメチルー3-メチルスルホニルー2-イソオキサゾリン0.35g(2.20 00ミリモル)のジメチルホルムアミド10m1溶液に、室温で水硫化ナトリウム 0.32g(純度70%,4.00ミリモル)を加え2時間攪拌した。その後反応溶液中に無水炭酸カリウム0.28g(2.00ミリモル)、ロンガリット0.31g(2.00ミリモル)及び5-クロロメチルー4-メトキシー6ートリフルオロメチルピリミジン0.45g(2.00ミリモル)を加え、更に室温で2時間攪拌した。反応終 7確認後、水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順

次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、5,5ージメチルー[(4ーメトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンー5ーイル)ーメチルチオ]ー2ーイソオキサゾリン0.55g(収率85.9%)を得た。

5 (1 H-NMR値 (CDC1 $_3$ /TMS δ (ppm)) : 8.81(1H, s), 4.44(2H, d), 4.12(3H, s), 2.81(2H, s), 1.45(6H, s)

<実施例40>

5,5-ジメチルー[(4-メトキシー6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メチルスルホニル]-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号8-000

10 1)の製造

20

5,5-ジメチルー [(4-メトキシー6-トリフルオロメチルピリミジンー5-イル)-メチルチオ]-2-イソオキサゾリン0.55g(1.71ミリモル)のクロロホルム20m1溶液に、氷冷下でm-クロロ過安息香酸1.05g(純度70%,4.28ミリモル)を加え1時間攪拌し、更に室温で4時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、白色羽毛状結晶(融点175~176℃)の5,5-ジメチルー[(4-メトキシー6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メチルス

('H-NMR値 (CDC1₃/TMS δ (ppm)) : 8.89(1H, s), 5.00(2H, d), 4.11(3H, s), 3.11(2H, s), 1.53(6H, s)

ルホニル]-2-イソオキサゾリンO.45g(収率75.0%)を得た。

<実施例41>

3-(5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン-3-イルチオメチル)-2-ト 25 リフルオロメチル-6,7ジヒドロ-5H-ピラゾロ[5,1-b][1,3]オキサジ

ン(本発明化合物番号3-0033)の製造

水素化ナトリウム 0.11g(2.8ミリモル)のN, N-ジメチルホルムアミド1 5m1懸濁液に3ー[5ークロロー1ー(3ーヒドロキシプロピル)-3ートリフル オロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルーメチルチオ]ー5,5ージメチルー2 ーイソオキサゾール 0.82g (2.3ミリモル) のN, Nージメチルホルムアミド 5m1溶液を室温で滴下した。滴下終了後、反応溶液を室温で30分攪拌し、その 後100℃に加熱し1時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸 エチルで抽出した。有機層をクエン酸水溶液、食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウム で乾燥した。減圧下溶媒を留去し、3-(5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリ ンー3ーイルチオメチル)ー2ートリフルオロメチルー6、7ジヒドロー5Hーピ ラゾロ[5,1-b][1,3]オキサジン0.77g(収率100%)を得た。 $(^{1}H-NMR値(CDC1_{3}/TMS \delta(ppm)): 4.37(2H, t), 4.19(2H, t), 4.15(2H, s),$ 2.80(2H, s), 2.31(2H, m), 1.42(6H, s)

<実施例42>

15 3-(5,5-ジメチル-2-イソオキサブリン-3-イルスルホニルメチル)-2-トリフルオロメチルー6, 7-ジヒドロー5Hーピラゾロ[5, 1-b][1, 3]オキサジン(本発明化合物番号3-0019)の製造

3-(6,7-i) + ib[[1,3]]]]]]] [1,3]]]]] [1,3]]] [1,3]]] [1,3]]] [1,3]]] [1,3]]] [1,3]] [1,3]] [1,3]] [1,3]] [1,3]] [1,3]] [1,3]] [1,3]] [1,3] [1サンリン0.77g (2.3ミリモル) のクロロホルム溶液 20mlに、氷冷下、m 20 ークロロ過安息香酸1.25g(純度70%, 5.1ミリモル)を加え1時間攪拌し た。その後、更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ クロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水 素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾 燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製 25

し、白色粉末(融点151.0-152.0°C)の3-(5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン-3-イルスルホニルメチル)-2-トリフルオロメチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピラゾロ[5,1-b][1,3]オキサジン0.36g(収率43%)を得た。

 δ (¹H-NMR値 (CDC1₃/TMS δ (ppm)) :4.47(2H, s), 4.40(2H, t), 4.23(2H, t), 3.09(2H, s), 2.34(2H, m), 1.50(6H, s)

次に、一般式 [I] を有する本発明化合物の代表的な化合物例の物性例を表 1 1 ~表 2 0 に記載する。尚、化合物番号は上記実施例に記載したものに対応する。

表11

R^{1} R^{2} R^{3} R^{4} R^{6} R^{22} R^{23} R^{24}												
化合物番号	R ¹	R ²	R³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z_1	R ²²	R ²³	R ²⁴	融点(°C) 又は 屈折率 (n _D ²⁰)
1-0001	Me	Me	H	Н	2	H	H	S	Me	Н	H	66-68
1-0002	Ме	Me	Н	н	2	Н	Н	S	Cl	Me	Н	87-88
1-0003	Me	Me	H	Н	2	Н	Н	S	Н	Н	Ме	95-97
1-0004	Ме	Me	H	H	2	Н	Н	S	Cl	Н	н	70-72
1-0005	Me	Me	Н	H	2	Н	н	S	Н	Н	C1	118-119
1-0006	Me	Me	H	н	2	Н	Н	0	н	H	н	測定不可
1-0007	Me	Me	Н	H	2	Н	Н	0	H	H	C(=O)OMe	124-125

表12

表13

															
	$ \begin{array}{c} R^{2} \\ R^{3} \\ R^{4} \end{array} $ $ \begin{array}{c} R^{29} \\ R^{6} \end{array} $ $ \begin{array}{c} N \\ R^{28} \end{array} $														
化合物 番 号	R ¹	R²	R³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ²⁹	R ²⁸	R ³⁰	融点(℃)又は 屈折率(np ²⁰)				
3-0001	Me	Me	Н	Н	0	Н	H	CF₃	Ph	Cl	89-90				
3-0002	Ме	Ме	н	H	2	Н	н	CF₃	Ph	Cl	132-133				
3-0003	Ме	Me	Н	н	1	н	H	Ph	Ме	C1	測定不可				
3-0004	Ме	Ме	н	Н	2	Н	Н	CF₃	Ph	SO₂Et	158-160				
3-0005	Ме	Ме	н	Н	2	Н	Н	CF ₃	Ph	N(Me) ₂	150-151				
3-0006	Ме	Ме	н	н	0	Н	н	CF ₃	Bu-t	C1	79-81				
3-0007	Ме	Ме	н	Н	0	Н	Н	CF₃	н	CI	120-122				
3-0008	Ме	Ме	н	Н	0	Н	н	CF₃	CHF ₂	C1	41-42				
3-0009	Me	Ме	н	н	0	н	Н	Cl	CHF ₂	CF ₃	89-90				
3-0010	Me	Ме	н	Н	2	Н	Н	CF ₃	CHF ₂	CI	126-127				
3-0011	Me	Ме	Н	Н	2	Н	Н	C1	CHF ₂	CF ₃	136-137				
3-0012	Me	Ме	Н	Н	2	Н	Н	OEt	Me	CF ₃	124-125				
3-0013	Ме	Ме	н	Н	2	Н	Н	CF ₃	Me	ОМе	113-114				
3-0014	Me	Ме	н	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-Cl)Ph	67-70				
3-0015	Me	Ме	н	H	2	Н	Н	CF₃	Me	OPen-c	113-114				
3-0016	Me	Ме	н	Н	2	Н	Н	CF ₃	Me	CN	105-108				
3-0017	Me	Ме	н	Н	2	Н	H	CI	Et	CI	105-107				
3-0018	Me	Me	Н	H	2	Н	Н	CHF ₂	Me	CI	78-79				
3-0019	Me	Ме	н	H	2	Н	H	CF ₃	-(CH ₂)₃O-		151-152				
3-0020	Me	Me	н	Н	0	Н	H	CHF ₂	Me	CI	1.5183				
3-0021	Me	Me	н	Н	0	H	Н	CF ₃	Ph	F					
3-0022	Me	Me	Н	Н	0	Н	H	CF ₃	Ph	SEt					
3-0023	Me	Me	Н	Н	0	Н	H	CF₃	Ph	N(Me)2					
3-0024	Me	Ме	Н	Н	0	Н	H	ОМе	Me	CF ₃					
3-0025	Me	Me	Н	Н	0	Н	Н	ОН	Ме	CF₃					
3-0026	Me	Me	н	Н	0	Н	Н	OEt	Me	CF ₃					
3-0027	Me	Ме	н	Н	0	н	H	CF ₃	Me	F					
3-0028	Me	Me	Н	Н	0	Н	Н	CF ₃	Ме	ОМе					
3-0029	Ме	Ме	Н	н	0	Н	н	CF ₃	Ме	O(2-Cl)Ph					

								-			
3-0030	Me	Ме	Н	Н	0	Н	H	CF ₃	Ме	OPen-c]
3-0031	Me	Me	н	Н	0	н	H	CF ₃	Me .	CN	
3-0032	Ме	Me	н	н	0	Н	Н	CI	Et	Cı	
3-0033	Ме	Me	н	н	0	н	н	CF₃	-(CH ₂) ₃ O-	•	
3-0034	Me	Me	H	н	2	H	н	CF ₃	Н	Cl	138-140
3-0035	Ме	Me	н	н	2	Н	Н	н	Ме	Cı	105-106
3-0036	Ме	Me	н	н	2	н	Н	Ме	Ме	Ме	148-150
3-0037	Ме	Me	н	н	2	н	Н	Me	Ме	CI	99-101
3-0038	Ме	Me	н	н	2	н	H	CI	Ме	Cı	143-145
3-0039	Ме	Me	Н	Н	2	н	H	CF₃	Ме	Cı	115-116
3-0040	Me	Me	н	н	2	н	Н	CI	Ме	CF ₃	120-122
3-0041	Me	Ме	н	н	2	н	Н	CF ₃	Me	F	79-82
3-0042	Me	Me	H	Н	2	н	н	CF ₃	Ме	он	90-92
3-0043	Ме	Me	н	H	2	н	H	ОМе	Ме	CF₃	125-126
3-0044	Me	Me	Н	Н	2	н	н	CF ₃	Ме	OEt	92-94
3-0045	Ме	Me	н	н	2	н	н	CF₃	Ме	OPr-i	69-71
3-0046	Me	Me	н	н	2	н	Н	CF₃	Ме	OPr	82-83
3-0047	Ме	Me	н	н	2	н	Н	CF ₃	Ме	OBu-t	86-89
3-0048	Ме	Me	H	н	2	H	н	CF ₃	Ме	OBu	61-62
3-0049	Ме	Me	н	н	2	Н	н	CF ₃	Ме	ОНех-с	124-125
3-0050	Me	Me	н	н	2	H	H	CF ₃	Ме	OCH₂Pr-c	93-94
3-0051	Ме	Me	н	н	2	Н	н	CF ₃	Me	OCH ₂ Pen-c	112-113
3-0052	Ме	Me	Н	Н	2	Н	н	CF ₃	Ме	OCH₂Hex-c	56-59
3-0053	Me	Me	Н	Н	2	н	н	CF ₃	Me	осн₂с≡сн	92-93
3-0054	Ме	Me	н	н	2	н	н	CF ₃	Ме	OCHF ₂	129-130
3-0055	Me	Me	Н	Н	2	н	н	OCHF ₂	Me	CF ₃	測定不可
3-0056	Me	Me	H	Н	2	н	H	CF ₃	Ме	OCH ₂ CHF ₂	89-91
3-0057	Me	Me	Н	Н	2	н	н	CF ₃	Ме	OCH₂CF₃	93-95
3-0058	Me	Me	H	H	2	Н	H	CF ₃	Ме	OCH₂CN	1.4872
3-0059	Me	Me	H	н	2	н	н	CF ₃	Ме	OCH₂Ph	79-81
3-0060	Me	Me	н	н	2	н	н	CF ₃	Ме	OPh	122-123
3-0061	Me	Me	н	н	2	Н	н	CF ₃	Ме	O(3-Cl)Ph	測定不可
3-0062	Me	Me	н	н	2	H	Н	CF ₃	Ме	O(3-OMe)Ph	1.5059
3-0063	Me	Me	н	Н	2	н	н	CF ₃	Me	O(4-Cl)Ph	68-69
3-0064	Me	Me	н	Н	2	н	Н	CF ₃	Ме	O(4-Me)Ph	132-133
3-0065	Me	Me	н	н	2	н	н	CF ₃	Me	O(4-OMe)Ph	115-117
3-0066	Me	Me	Н	Н	2	н	н	CF₃	Ме	OC(≔O)Me	130-131
3-0067	Me	Ме	н	Н	2	н	н	CF ₃	Ме	SO₂Me	168-169

1	1		1	ا ۔۔ ا	_ 1	1		l	L.	lon.	100 100	l
3-0068	Me	Me	H	Н	2	Н			Me	SEt	100-102	
3-0069	Me	Me	Н	Н	2	H		CF₃	Me	SO₂Et	107-108	
3-0070	Me	Me	H	Н	2	H	H	1	Me	SO₂Ph	166-168	ĺ
3-0071	Me	Ме	Н	H	2	H		CF ₃	Ме	Ме	105-107	ı
3-0072	Me	Me	Н	H	2	Н	H	Ph	Me	Cl	127-129	
3-0073	Me	Ме	Н	H	2	H	H	CF₃	Et	CI	111-112	
3-0074	Me	Me	Н	H	2	Н	H	Cl	Et	CF₃	112-114	
3-0075	Me	Me	н	H	2	Н	H	CF ₃	Pr-i	Cl	157-158	
3-0076	Ме	Ме	Н	Н	2	Н	H	CI	Pr-i	CF ₃	135-136	
3-0077	Me	Ме	н	Н	2	н	H	CF ₃	Pr	C1	89-90	
3-0078	Me	Me	н	Н	2	н	H	Cl	Pr	CF ₃	111-113	ĺ
3-0079	Me	Me	н	н	2	н	H	CF ₃	Bu-t	н	101-103	
3-0080	Ме	Me	н	н	2	н	Н	CF ₃	Bu-t	Cl	118-119	
3-0081	Me	Me	н	Н	2	Н	н	CF₃	Bu-s	Cı	110-112	
3-0082	Ме	Ме	Н	н	2	Н	н	CI	Bu-s	CF ₃	110-111	
3-0083	Ме	Me	н	н	2	Н	Н	CF₃	Bu-i ·	CI	96-98	
3-0084	Me	Me	н	н	2	Н	H	CI	Bu-i	CF ₃	140-141	
3-0085	Me	Me	Н	н	2	Н	Н	CF₃	Bu	Cı	89-90	
3-0086	Me	Me	Н	H.	2	н	Н	Cl	Bu	CF ₃	108-110	
3-0087	Ме	Me	H	н	2	Н	Н	CF ₃	CH₂Ph	Cl	132-133	
3-0088	Ме	Me	н	Н	2	Н	Н	Cl	CH₂Ph	CF₃	118-120	
3-0089	Me	Me	Н	Н	2	Н	Н	CF ₃	Pen-c	CI	130-131	
3-0090	Me	Me	н	Н	2	Н	H	Cl	Pen-c	CF₃	147-148	
3-0091	Ме	Me	Н	н	2	Н	H	CF ₃	Нех-с	CI	151-152	
3-0092	Ме	Me	н	Н	2	Н	Н	CF ₃	CH₂Pr-c .	C1	93-95	
3-0093	Ме	Me	н	Н	2	Н	H	CI	CH₂Pr-c	CF ₃	129-130	
3-0094	Me	Me	Н	н	2	Н	Н	CF ₃	1-cyclopropylethyl	Cl	87-89	
3-0095	Ме	Me	Н	н	2	H	Н	Cl	1-cyclopropylethyl	CF ₃	121-123	i
3-0096	Ме	Me	Н	H	2	Н	H	CF ₃	CH ₂ (2-Methylcyclopropyl)	CI	102-103	
3-0097	Me	Me	н	Н	2	Н	Н	CI	CH ₂ (2-Methylcyclopropyl)	CF₃	118-119	í
3-0098	Me	Ме	Н	Н	2	н	Н	CF ₃	CH ₂ Bu-c	CI	94-96	
3-0099	Me	Me	Н	Н	2	Н	Н	Cl	CH₂Bu-c	CF₃	141-142	ì
3-0100	Me	Me	Н	Н	2	Н	H	CF ₃	CH₂Pen-c	CI	127-129	ì
3-0101	Me	Me	н	Н	2	Н	Н	CI	CH₂Pen-c	CF ₃	146-149	ì
3-0102	Me	Me	H	Н	2	Н	Н	CF ₃	CH₂Hex-c	Cl	152-154	
3-0103	1	Me	1		1	i i	н	i	CH₂Hex-c	CF ₃	115-117	1
3-0104	ł	Me	1	1	2	1	Н	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CI	78-80	
3-0105	1	Me	1	1	1	Н		CI	CH ₂ CH=CH ₂	CF ₃	105-106	

3-0106	Me	Me	н	н	2	н	Н	CF ₃	СН₂С≡СН	cı [73-74	
3-0107	Me	Me	н	н	2	н	н	CI	СН₂С≡СН	CF₃	108-109	
3-0108	Me	Me	н	н	2	н	н	CF₃	СНМеС≡СН	Cı	95-96	
3-0109	Мe	Me	н	н	2	н	н	Cl	СНМеС≡СН	CF₃	116-118	
3-0110	Me	Me	н	н	2	н	н	CF₃	CH ₂ C≡CMe	C1	114-115	
3-0111	Me	Ме	H	н	2	н	н	Cl	CH₂C≡CMe	CF₃	115-116	
3-0112	Me	Me	н	н	2	н	н	CF₃	CHF ₂	ОМе	72-74	
3-0113	Ме	Me	н	н	2	н	н	ОМе	CHF₂	CF₃	108-109	
3-0114	Ме	Ме	н	н	2	н	н	CF₃	CH2CHF2	CI	99-100	
3-0115	Me	Ме	H	н	2	н	Н	Cl	CH ₂ CHF ₂	CF₃	107-109	
3-0116	Me	Ме	н	н	2	н	н	CF ₃	CH ₂ CF ₃	CI	135-136	
3-0117	Me	Me	н	н	2	н	H	Cl	CH ₂ CF ₃	CF₃	112-115	
3-0118	Me	Me	н	н	2	н	н	CF ₃	CH ₂ OMe	CI	87-89	
3-0119	Ме	Me	н	н	2	н	н	Cl	CH₂OMe	CF₃	125-128	
3-0120	Me	Me	н	н	2	н	Н	CF₃	CH ₂ OEt	Ci	97-98	
3-0121	Me	Ме	н	н	2	н	н	Cı	CH₂OEt	CF₃	128-129	
3-0122	Ме	Me	H	н	2	н	н	CF₃	CH₂CH₂OH	Cı	79-81	
3-0123	Me	Ме	Н	н	2	н	н	Cl	CH₂CH₂OH	CF ₃	93-94	
3-0124	Ме	Ме	Н	н	2	H	H	CF ₃	CH₂CH₂OMe	Cl	102-104	
3-0125	Me	Me	H	H	2	н	н	Cı	CH₂CH₂OMe	CF₃	118-119	
3-0126	Me	Me	Н	Н	2	Н	Н	CF ₃	CH₂CH₂OEt	CI	56-59	
3-0127	Ме	Me	Н	H	2	н	н	Cı	CH₂CH₂OEt	CF₃	118-119	
3-0128	Ме	Ме	Н	Н	2	н	Н	CF₃	CH ₂ SMe	Cl	103-105	
3-0129	Me	Me	Н	Н	2	H	Н	Cl	CH ₂ SMe	CF ₃	128-129	
3-0130	Me	Me	H	Н	2	Н	Н	CF₃	CH ₂ SO ₂ Me	Cl	157-159	
3-0131	Ме	Me	H	Н	2	H	Н	Cl	CH₂SO₂Me	CF ₃	165-166	
3-0132	Ме	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH₂CH₂SO₂Me	CI	155-157	
3-0133	Me	Me	H	H	2	Н	Н	CI	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	166-168	
3-0134	Ме	Me	H	H	2	H	H	CF₃	CH ₂ CN	Cl	128-129	
3-0135	Me	Ме	H	Н	2	H	H	Cl	CH ₂ CN	CF ₃	117-118	
3-0136	Me	Me	H	H	2	Н	Н	CF ₃	CH ₂ C(=O)OEt	Cl	127-129	
3-0137	Me	Me	H	H	2	Н	Н	Cl	CH ₂ C(=O)OEt	CF ₃	143-145	
3-0138	Me	Ме	H	H	2	H	н	CF ₃	CH ₂ C(=O)NH ₂	Cl	173-174	
3-0139	Me	Ме	H	H	2	Н	Н	Cl	CH ₂ C(=O)NH ₂	CF ₃	182-183	
3-0140	Me	Me	H	Н	2	Н	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	CI	142-143	
3-0141	Me	Me	H	Н	2	Н	H	Cl	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	CF ₃	181-182	
3-0142	Me	Me	H	Н	2	н	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)Me	CI	148-149	
3-0143	Me	Me	H	H	2	Н	H	CI	CH ₂ C(=O)Me	CF ₃	163-164	

											9	
3-0144	Me	Me	Н	н	2	Н	н	lo	F ₃	CH ₂ CH ₂ C(=O)Me	C1	89-91
3-0145	Me	Me	Н	Н	2	Н		M		Ph	Me	140-141
3-0146	Me	Me	Н	Н	2	н	н	V	⁄le	Ph .	C1	124-125
3-0147	Ме	Me	Н	Н	2	Н	н	E	it	Ph ·	CI	112-113
3-0148	Me	Me	Н	Н	2	Н	Н	P	T I	Ph	CI	122-123
3-0149	Ме	Me	Н	Н	2	Н	Н	P	r-i	Ph	CI	116-117
3-0150	Me	Me	Н	н	ļ	Н	Н	E	Bu-t	Ph	C1	100-102
3-0151	Me	Me	Н	Н	1	Н	H		CF ₃	Ph	н	111-112
3-0152	Me	Me	н	Н	1	Н	Н	ı	CF ₃	Ph	Me	129-132
3-0153	Me	Me	н	1	1	Н	В	ı	CF ₃	Ph	CF ₃	112-113
3-0154	Me	1	Н	ı	1	Н	H	1	CF ₃	Ph	F	90-91
3-0155	Me	1	ı		1	1	F	ı k	CF ₃	Ph	ОМе	104-106
3-0156	Me	1	1	1	1	1	F	ιk	CF ₃	Ph	OEt	129-131
3-0157	Me	1	1	1	1	1	F	ı k	CF₃	Ph	OPr-i	86-88
3-0158	Me	1	1	1	1	1	H	1	CF ₃	Ph	OPr	117-118
3-0159	Me	1	1	H	ı ₂	Н	F	1	CF₃	Ph	OBu-t	105-108
3-0160	Me	Me	Н	H	[2	Н	ŀ	1	CF₃	Ph	OCHF ₂	90-92
3-0161	Me	1)	E	[2	Н	I	1	CF ₃	Ph	SO₂Me	167-168
3-0162	Me	Me	H	ı l	1 2	: Н	I	1	CF ₃	Ph	CN	113-115
3-0163	Me	Me	H	I F	1 2	2 H	1	1	CF ₃	(2-Cl)Ph	Cl	153-154
3-0164	Me	Me	H	I F	1 2	2 H	ı	1	CF ₃	(3-CI)Ph	Cl	106-107
3-0165	- 1	M	H	1 I	1 2	2 H	[] J	H	CF ₃	(4-Cl)Ph	Cl	142-143
3-0166	Me	e M	e F	I I	1 :	2 H	[]	H	CF ₃	(4-F)Ph	Cl	135-138
3-0167	M	e M	e F	1 I	1 :	2 H	[]:	H	CF₃	(4-OMe)Ph	CI	136-138
3-0168	M	e M	e F	1 I	I :	2 F	I 1	H	CF ₃	(4-Me)Ph	Cl	129-130
3-0169	M	e M	e F	4 J	I	2 F	1	Н	CF ₃	(4-NO ₂)Ph	Cl	145-147
3-0170	M	еМ	e I	1 1	H :	2 F	1	Н	CF ₃	(4-CN)Ph	CI	91-93
3-0171	м	еМ	e I	H 1	H :	2 I	1 1	Н	CF ₃	(4-C(=O)Me)Ph	CI	133-135
3-0172	2 M	e M	e I	H 1	H	2 I	I	H	CF ₃	(4-C(=O)OMe)Ph	Cl	121-124
3-0173	з М	e M	e 1	H]	H	2 I	1	H	CF3	Pyrmidin-2-yl	CI	148-150
3-0174	ı М	e M	ie 1	H :	H	2 I	I	H	CF3	4,6-Dimethoxypyrmidin- 2-yl	CI	117-118
3-017	5 M	le M	le l	H :	н	2 1	1	H	CF ₃	SO₂Me	CI	146-148
3-0170	6 M	[e M	le i	H	H	2 1	H	H	CF ₃	SO₂Ph	CI	145-148
3-017		Ie M	[e	H	н	2 1	H	H	CF ₃	C(=O)Me	CI	130-131
3-017	1	Ie M	le :	Η	н	2	H	H	CF ₃	C(=O)Ph	CI	114-117
3-017		- 1	- 1	- 1	н	2	H	H	CF ₃	C(=O)OMe	CI	104-106
3-018	- 1	l l	- 1	н	н	2	H	H	CF ₃	Me	CI	108-110

3-0181	Me	Ме	н	н	0	н	H	CHF₂	Ме	CI	1.5183
3-0182	Me	Me	н	н	0	н	H	Ph	Ме	CI	76-77
3-0183	Ме	Ме	Н	н	0	н	H	CF₃	Bu-t	ОМе	1.4831
3-0184	Me	Ме	H	н	0	н	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)NH ₂	CI	179-180
3-0185	Me	Me	Н	Н	0	н	H	Me	Ph	CI	58-60

表14

X1-1															
	$ \begin{array}{c c} R^2 & R^3 & R^4 \\ R^1 & & & R^{31} \\ \hline & & & & & \\ & & & & & \\ & & & & & \\ & & & &$														
化合物 番号 R ² R ³ R ⁴ n R ⁵ R ⁶ Z ³ R ³¹ R ³² 融点(℃) 又は 屈折率 (n _p ²⁰)															
4-0001	Ме	Н	Н	2	Н	H	0	CF ₃	Me	135-136					
4-0002	Me	H	н	2	Н	H	S	Me	Cl	113-114					
4-0003	Ме	Н	н	0	H	H	О	CF ₃	Me						
4-0004	Me	H	н	0	Н	H	S	Me	Cl						
4-0005	Me	Н	Н	2	H	H	0	Me	Me	178-179					
4-0006	Me	H	н	2	Н	Н	0	CF ₃	OEt	89-91					
4-0007	Me	H	H	2	Н	Н	O	Ph	Me	81-83					
4-0008	Me	Н	Н	2	Н	H	S	Me	OEt	109-111					

WO 02/062770 PCT/JP02/01015

表15

$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$														
化合物番号	R^1	R ²	\mathbb{R}^3	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁴	R ³³	R ³⁴	融点(℃)又は 屈折率(np ²⁰)			
5-0001	Me	Me	H	H	2	Н	H	Nme	C1	Me	114-115			
5-0002	Me	Me	Н	H	2	Н	Н	Nme	CI	Et	107-108			
5-0003	Мe	Me	Н	Н	2	Н	Н	Nme	CF ₃	H	142-143			
5-0004	Me	Me	Н	Н	2	Н	Н	NCHF ₂	-(CH ₂) ₄ -		123-125			
5-0005	Me	Me	Н	H	2	Н	Н	NPh	OEt	Ме	1.5397			
5-0006	Me	Me	Н	Н	2	Н	Н	NPh	OCHF ₂	Ме	1.5339			
5-0007	Me	Me	Н	Н	2	Н	Н	NPh	CF ₃	H	99-101			
5-0008	Me	Me	H	Н	2	Н	Н	NPh	OCH ₂ CH=CH ₂	Ме	87-90			
5-0009	Me	Me	H	Н	1	H	Н	NPh	OCH₂CH=CH₂	Ме	1.5702			

表16

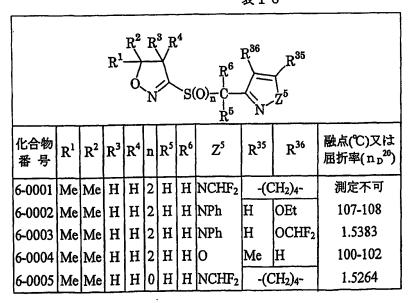


表17

	X1.														
	$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$														
化合物 R ¹ R ² R ³ R ⁴ n R ⁵ R ⁶ R ³⁷ R ³⁸ R ³⁹ R ⁴⁰ 融点(℃)又は 屈折率(n _D ²⁰)															
7-0001															
7-0002	Ме	Me	н	H 2 H H H CF ₃ H H N-oxide 114-116											
7-0003	Ме	Me	н	н	0 H H H CF ₃ H H -										
7-0004	Ме	Me	н	н	2	H	н	. H	н	н	н	-	130-131		
7-0005	Ме	Me	Ħ	н	2	н	н	н	H	н	Н	N-oxide	166-168		
7-0006	Ме	Me	н	н	2	н	н	Cl	Ph	н	н	-	118-120		
7-0007	Ме	Me	н	н	2	н	н	Ome	Ph	н	н	-	105-106		
7-0008	Ме	Me	н	н	2	н	н	CI	Me	н	H	. -	115-116		
7-0009	Me	Me	н	Н	2	н	Н	Ome	Me	н	H	-	134-135		
7-0010	Me	Me	н	н	2	н	н	Ме	Me	н	н	N-oxide	198-199		
7-0011	Me	Ме	н	н	2	н	н	Ph	Ph	н	н	-	161-162		
7-0012	Me	Me	н	н	1	н	н	н	н	н	H	-	97-99		
7-0013	Ме	Me	Н	н	0	Н	н	(2-Chloropyridin- 3-yl)methylthio	H	н	н	-	154-155		

WO 02/062770

表18

	R^{1} C N $S(O)$ R^{6} R^{43} R^{41} R^{5} R^{41}														
化合物 番号	化合物 R ¹ R ² R ³ R ⁴ n R ⁵ R ⁶ R ⁴¹ R ⁴² R ⁴³ 融点(℃)又は 屈折率(n _D ²⁶)														
8-0001															
8-0002	Me	Ме	Н	Н	0	Н	H.	H	OMe	CF ₃					
8-0003	Me	Ме	Н	H	2	H	H	н	Cl	C1	119-120				
8-0004	Me	Ме	H	H	2	H	Н	H	OEt	CF₃	94-95				
8-0005	Me	Ме	H	Н	2	H	H	H	OMe	OMe	186-187				
8-0006	Me	Ме	Н	H	2	H	H	Me	OMe	CF ₃	143-144				
8-0007	Me	Me	Н	H	2	H	H	ОМе	OMe	CF ₃	144-145				
8-0008	Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OMe	CF₃	160-162				
8-0009	Me	Ме	H	Н	2	Н	Н	SO ₂ Me	OMe	CF ₃	144-146				
8-0010	Me	Me	Н	Н	2	Н	н	NH ₂	OMe	CF ₃	208-209				
8-0011	Me	Me	Н	Н	2	Pr-i	H	н	Н	CF ₃	112-113				
8-0012	Ме	Me	H	Н	0	Pr-i	H	Н	Н	CF ₃	1.4986				

表19

_								衣 1 9							
	$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$														
化合物 番号	番号 R R R R R R R E E E														
9-0001															
9-0002	Me	Me	Н	Н	2	Н	Н	Pyridin-2-yl 1-oxide	140-143						
9-0003	Me	Me	Н	Н	2	Ή	Н	Pyridin-4-yl	133-136						
9-0004	Me	Me	н	Н	2	Н	Н	Pyridin-4-yl 1-oxide	110-113						
9-0005	Me	Me	Н	Н	2	H	Н	1,2,4-Oxadiazol-3-yl	測定不可						
9-0006	Me	Me	Н	Н	2	Н	H	3-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl	153-154						
9-0007	Me	Me	н	Н	2	H	H	3-Benzyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl	108-109						
9-0008	Me	Me	Н	Н	2	Н	Н	2-Chlorothiazol-4-yl	110-112						
9-0009	Me	Me	Н	Н	2	Н	Н	1,4-Dimethylimidazol-5-yl	163-164						
9-0010	Me	Me	Н	H	1	Н	Н	Pyridin-2-yl	81-82						
9-0011	Me	Me	Н	н	1	Н	Н	Pyridin-4-yl	94-96						
9-0012	Me	Me	Н	Н	1	Н	Н	1,4-Dimethylimidazol-5-yl	138-140						
9-0013	Me	Me	Н	Н	0	H	H	1,4-Dimethylimidazol-5-yl	1.5427						

表20

	$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$														
化合物番号	R¹	R²	R³	R⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y¹	融点(℃)又は 屈折率(n _p ²⁰)						
10-0001	Me	Me	Н	Н	2	Н	H	Benzimidazol-2-yl	171-174						
10-0002	10-0002 Me Me H H 2 H H Benzothiophen-2-yl 181-183														
10-0003	10-0003 Me Me H H 2 H H 3-Chlorobenzothiophen-2-yl 109-112														
10-0004	10-0004 Me Me H H 2 H H Benzotriazol-1-yl 206-207														
10-0005	0-0005 Me Me H H 2 H H 1-Methylindazol-4-yl 128-130														
10-0006	Me	Me	H	Н	2	Н	·H	Benzothiazol-2-yl	142-143						
10-0007	Me	Me	Н	Н	2	H	Н	Benzothiophen-3-yl	188-191						
10-0008	Me	Me	Н	Н	2	H	H	5-Chlorobenzothiophen-3-yl	129-130						
10-0009	Me	Me	Н	Н	2	Н	Н	Benzoxazol-2-yl	127-129						
10-0010	Me	Ме	H	H	2	H	H	3-Methylbenzothiophen-2-yl	161-163						
10-0011	Me	Me	H	H	2	Н	H	3-Bromobenzothiophen-2-yl	118-119						
10-0012	Me	Ме	H	H	2	H	H	Benzofuran-2-yl	123-124						
10-0013	Me	Me	Н	H	2	Н	Н	2-Methylbenzofuran-7-yl	135-137						
10-0014	Me	Me	Н	Н	2	Н	Н	3-Bromobenzofuran-2-yl	107-108						
10-0015	Me	Me	H	Н	2	H	Н	Benzothiophen-7-yl	95-97						
10-0016	Me	Me	H	Н	2	Н	H	1-Methylindazol-7-yl	89-90						
10-0017	Me	Me	Н	Н	2	н	Н	3-Methylbenzofuran-2-yl	111-112						
10-0018	Me	Me	Н	H	2	Н	Н	3-Chloro-1-methylindol-2-yl	162-165						

(中間体の製造例)

<参考例1>

5 3ークロロー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリンの製造

グリオキシル酸アルドオキシム182.7g (2.05モル) の1,2ージメトキシエタン21溶液に、 $65\sim70$ でNークロロこはく酸イミド534.0g (4.0モル) を徐々に加えた後、1時間加熱還流した。氷冷下、炭酸水素カリウム14

40.0g(14.4モル)及び水10m1を加えた後、2ーメチルプロペン360.0g(6.4モル)を反応溶液に加え、室温で24時間攪拌した。反応溶液を水中に注ぎジイソプロピルエーテルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、黄色粘調性液体の3ークロロー5,5ージメチルー2ーインオキサゾリン107.7g(収率40.0%)を得た。

($^{1}H-NMR$ 値 (CDC1₃/TMS δ (ppm)) :2.93(2H, s)、1.47(6H, s)

<参考例2>

3-クロロー5-エチルー5-メチルー2-イソオキサゾリンの製造

- 10 グリオキシル酸アルドオキシム20.6g(231.7ミリモル)の1,2ージメトキシエタン500m1溶液に、60℃でNークロロこはく酸イミド61.9g(463.4ミリモル)を徐々に加えた。加え終わった後、10分間加熱還流した。次に、氷冷下、2ーメチルー1ープテン50m1(463.4ミリモル)、炭酸水素カリウム98.9g(1622ミリモル)及び水10mlを加え12時間攪拌した。
- 15 反応溶液を水中に注ぎ n ーヘキサンで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、淡黄色粘調性液体の3-クロロ-5-エチル-5-メチル-2-イソオキサゾリン13.9g(収率40.6%)を得た。

(¹H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)):2.91(2H, ABq, J=17.0, $\Delta \nu$ =46.1Hz), 1.73(2H, q)、20 1.42(3H, s)、0.96(3H, t)

<参考例3>

3ーベンジルチオー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリンの製造 ベンジルメルカプタン2.8g (22.5ミリモル)のN,Nージメチルホルムア ミド50m1溶液に、窒素気流下、無水炭酸カリウム3.2g (23.2ミリモル) 25 及び3ークロロー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリン3.0g (22.5ミリ モル)を加え100℃で2時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、黄色油状物質(屈折率 n_p²⁰=1.5521)の3ーベンジルチオー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリン3.1g(収率62.0%)を得た。(¹H-NMR値(CDC1₃/TMS δ (ppm)):7.24-7.39(5H, m)、4.26(2H, s)、2.77(2H, s)、1.40(6H, s)

<参考例4>

3 - (2,6 - ジフルオロベンジルスルフィニル) - 5 - エチル - 5 - メチル - 10 2 - イソオキサゾリンの製造

3-(2,6-ジフルオロベンジルチオ)-5-エチルー5-メチルー2-イソオキサゾリン4.1g(15.0ミリモル)のクロロホルム50ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸4.6g(純度70%、18.8ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、更に室温で12時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸カリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、白色粉末(融点30℃以下)の3ー(2,6-ジフルオロベンジルスルフィニル)-5-エチルー5-メチルー2ーイソオキサゾリン1.5g(収率34.8%)を得た。

(1H-NMR値(CDC1₃/TMS δ (ppm)):7.39-7.28(1H, m)、7.03-6.94(2H, m)、4.38(2H, s)、3.04(1H, ABq, J=17.2, $\Delta \nu$ =85.7Hz)+3.12(1H, s)、1.75(2H, m)、

1. 44(3H, s) + 1.41(3H, s), 0. 97(3H, m)

<参考例5>

10

ーイソオキサゾリンの製造

3-(2,6-i)フルオロベンジルスルフィニル)-5-xチルー2-iイソオキサゾリン0.8g(2.8ミリモル)のクロロホルム50m1溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1.0g(純度70%、4.1ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、更に室温で12時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸カリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:-キサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、白色粉末(融点64-65℃)の3-(2,6-iジフルオロベンジルスルホニル)-5-xチルー2-iイソオキサゾリン0.6g(収率5.0%)を得た。

('H—NMR値(CDC1₃/TMS δ (ppm)):7.36-7.46(1H, m)、6.98-7.04(2H, m)、4.73(2H, s)、3.04(2H, ABq, J=17.2, Δ ν =51.1Hz)、1.77(2H, q)、1.46(3H, s)、0.97(3H, t) <参考例6>

5,5ージメチルー3ーメチルスルホニルー2ーイソオキサゾリンの製造 3ークロロー5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリン143.0g(1.07モル)のN,Nージメチルホルムアミド500m1溶液に、氷冷下、メチルメルカプタンナトリウム水溶液1.0kg(含量15%、2.14モル)を滴下し、その後室温で12時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、5,5ージメチルー3ーメチルチオー2ーイソオキサゾリンを115.0g(収率74.1%)得た。この残渣(741.2ミリモル)をクロロホルム11に溶解し、氷冷下、mークロロ過安息香酸392.0g(純度70%、1.59モル)を加え1時間攪拌した。その後、更に室温で12時間攪拌した。反応終了後、析出したmークロロ安息香酸を濾別し、濾液を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、水、

炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで 乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄し、白色粉 末(融点82~84℃)の5,5-ジメチル-3-メチルスルホニル-2-イソオ キサゾリン77.6g(収率59.1%)を得た。

- 5 (¹H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)):3.26(3H, s)、3.12(2H, s)、1.51(6H, s) <参考例 7 >
- 5,5-ジメチルー3-エチルチオー2-イソオキサゾリンの製造 3-クロロー5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリンを含有した反応溶液に、 エチルメルカプタン560.0g(9.0モル)および水酸化ナトリウム360.0g 10 (9.0モル)の水溶液1500m1を加えた。その後、60~70℃で16時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、濃赤色油状の5,5-ジメチルー3-エチルチオー2-イソオキサグ
- 15 <参考例8>

リンの粗化合物 2 7 0.0 g 得た。

- 5,5ージメチルー3ーエチルスルホニルー2ーイソオキサゾリンの製造 5,5ージメチルー3ーエチルチオー2ーイソオキサゾリンの粗油状物270.0g(1.7モル)をクロロホルム1.01に溶解し、氷冷下、mークロロ過安息香酸1050g(純度70%,6.1モル)を加え1時間攪拌し、その後、更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、析出したmークロロ安息香酸を濾別し、濾液を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をnーヘキサンで洗浄し、白色粉末の5,5ージメチルー3ーエチルスルホニルー2ーイソオキサゾリン133.6g(収率65.4%)を得た。
- 25 <参考例9>

15

20

1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オールの製造

トリフルオロアセト酢酸エチルエステル34.1g(184.9ミリモル)のエタノール500ml溶液にフェニルヒドラジン20g(184.9ミリモル)及び濃塩酸4mlを加えた後、1時間加熱還流した。反応終了後、減圧下溶媒を大部分留去し、残渣に水を加えて結晶を析出させた。ろ過し、得られた結晶をろ液が中性になるまで水で洗浄した後、乾燥して、黄土色結晶の1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オール37.1g(収率87.9%)を得た。

('H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 7.68-7.41(5H, m), 5.86(1H, s), 3.71(1H, s)
<参考例10>

5 ー クロロー 1 ー フェニルー 3 ー ト リ フ ル オロ メ チ ルー 1 H ー ピラ ゾールー 4 ー カ ル ボ ア ル デ ヒ ド の 製造

N, N-ジメチルホルムアミド7.7g(105.2ミリモル)に、氷冷下、オキシ塩化リン33.6g(219.1ミリモル)を加えた。次に、室温で1-フェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー5-オール20g(87.7ミリモル)を加えた後、1時間加熱還流した。反応終了後、氷冷下、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、白色結晶の5-クロロー1-フェニルー3-トリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4-カルボアルデヒド19.1g(収率79.1%)を得た。

(1 H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 10.06(1H, s), 7.57(5H, s)

<参考例11>

(5-クロロー1-フェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー425 ーイル)ーメタノールの製造

水素化リチウムアルミニウム 0.21g(5.5ミリモル)のTHF 70m 1溶液を一30℃に冷却し、5ークロロー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーカルボアルデヒド3g(10.9ミリモル)のテトラヒドロフラン30m1溶液を徐々に加えた。更に30℃で30分間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルを加えて攪拌した後、水を加え、しばらく攪拌した。この反応混合物を減圧ろ過し、ろ液を酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、白色結晶の(5ークロロー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイル)ーメタノール3.0g(収率99.9%)を得た。

10 ('H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 7.54-7.51(5H, m), 4.71(2H, d), 1.79(1H, b) <参考例12>

4ープロモメチルー5ークロロー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1 Hーピラゾールの製造

(5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4
15 -イル)-メタノール3.0g(10.9ミリモル)のジエチルエーテル60ml溶液を-10℃に冷却し、三臭化リン1.0g(3.8ミリモル)を加え、更に室温で1時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、白色結晶の4-プロモメチル-5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール3.6g(収率95.8%)を得た。

(¹H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 7.58-7.48(5H, m), 4.48(2H, s) <参考例13>

5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒドの製造

25 5 ークロロー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4

ーカルボアルデヒド33.0g(120.1ミリモル)のジメチルスルホキシド500m1溶液に、ふっ化カリウム10.5g(180.2ミリモル)を加え、100℃で2時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン一酢酸エチル混合溶媒)で精製し、5ーフルオロー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーカルボアルデヒド26.5g(収率85.0%)を得た。

(1 H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 9.96(1H, s), 7.68-7.51(5H, m)

10 <参考例14>

(5-フルオロー1-フェニルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4-イル)-メタノールの製造

水素化ホウ素ナトリウム1.6g(41.0ミリモル)のメタノール300m1溶液に、氷冷下、5ーフルオロー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーカルボアルデヒド26.5g(102.5ミリモル)のメタノール200m1溶液を加え、0℃で30分間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(5ーフルオロー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイル)ーメタノール28.5g(収率100%)を得た。

('H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 7.65-7.41(5H, m), 4.68(2H, d), 1.73(1H, t)
<参考例15>

4 ープロモメチルー5 ーフルオロー1 ーフェニルー3 ートリフルオロメチルー 1 Hーピラゾールの製造

25 (5-フルオロー1-フェニルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー

15

25

4ーイル)ーメタノール27.5g(105.7ミリモル)のジエチルエーテル300ml溶液を0℃に冷却し、三臭化りん10.0g(37.0ミリモル)を加え、更に室温で2時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、4ープロモメチルー5ーフルオロー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾール30.3g(収率88.8%)を得た。

('H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 7.66-7.42(5H, m), 4.44(2H, s) <参考例16>

1 - tert - プチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - オール 10 の製造

トリフルオロアセト酢酸エチルエステル552.3g(3.0モル)のエタノール1500m1溶液にtertープチルヒドラジン塩酸塩373.8g(3.0モル)及び濃塩酸50m1を加えた後、2日間加熱還流した。反応終了後、減圧下溶媒を大部分留去し、残渣を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をnーヘキサンで洗浄し、白色粉末の1ーtertーブチルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー5ーオール369.0g(収率59.1%)を得た。

<参考例17>

1 ーtertープチルー5ークロロー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾール20 ー4ーカルボアルデヒドの製造

N, N-ジメチルホルムアミド87.7g(1.2モル)に、氷冷下、オキシ塩化リン462.0g(3.0モル)を加えた。次に、室温で1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オール208.2g(1.0モル)を加えた後、10時間加熱還流した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を水、5%水酸化ナトリウム水溶液及び水で順次洗浄した

後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、白色結晶の1-tertープチルー5ークロロー3ートリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4-カルボアルデヒド131.5g(収率21.7%)を得た。

5 (¹H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 9.97(1H, d), 1.76(9H, s)
<参考例18>

(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール -4-イル)-メタノールの製造

1 ーtertープチルー5 ークロロー3 ートリフルオロメチルー1 Hーピラゾール
10 ー4ーカルボアルデヒド39.9g(156.9ミリモル)のメタノール300m1
溶液を0℃に冷却し、水素化ホウ素ナトリウム6.5g(172.6ミリモル)を徐々に加え、更に室温で3時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(1 ーtertープチルー5 ークロロー3ートリフルオロメチルー1 Hーピラゾールー4ーイル)ーメタノール37.7g(収率93.6%)を得た。

('H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 4.60(2H, d), 1.72(9H, s), 1.58(1H, t) <参考例 1 9 >

4 ープロモメチルー 1 ーtertープチルー 5 ークロロー 3 ートリフルオロメチル 20 ー 1 Hーピラゾールの製造

(1-tert-プチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノール9.2g(35.7ミリモル)のジエチルエーテル100m 1溶液を-10℃に冷却し、三臭化リン11.6g(42.9ミリモル)を加え、更に室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。

減圧下溶媒を留去し、4ーブロモメチルー1ーtertーブチルー5ークロロー3ート リフルオロメチルー1Hーピラゾール10.0g(収率87.3%)を得た。

<参考例20>

15

25

(収率99.8%)を得た。

(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール -4-イル)-メタンチオールの製造

水硫化ナトリウム水和物21.8g(純度70%、272.2ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド300ml溶液に4ーブロモメチルー1ーtertープチルー5ークロロー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾール43.5g(136.1ミリモル)を加え、更に室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(1ーtertーブチルー5ークロロー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイル)ーメタンチオール32.3g(収率87.0%)を得た。

('H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 3.65(2H, d), 1.90(1H, t), 1.70(9H, s) <参考例21>

1-tert-ブチルー5-メトキシー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールの製造

1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オール 18.8g(90.3ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド100ml溶液に、 20 室温で無水炭酸カリウム15.0g(108.4ミリモル)及びヨウ化メチル19.3g(135.5ミリモル)を加え、更に15時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、1-tert ーブチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール20.0g

<参考例22>

1-tert-ブチルー4-クロロメチルー5-メトキシー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールの製造

1-tert-ブチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾー

5 ル20.0g(90.1ミリモル)の酢酸90m1溶液に、パラホルムアルデヒド5.
4g(ホルムアルデヒド換算180.2ミリモル)及び濃塩酸20m1を加え60℃で30分間加熱攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジイソプロピルエーテルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、1-tert-ブチル-4-クロロメチル-5-メトキシ

10 -3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール21.7g(収率89.0%)を得た。
<参考例23>

3-メトキシー1-メチルー5-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールの製造

3ーヒドロキシー1ーメチルー5ートリフルオロメチルー1Hーピラゾール1 0.0g(60.2ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド50m1溶液に、室温で無水炭酸カリウム10.0g(72.3ミリモル)及びヨウ化メチル12.8g(90.3ミリモル)を加え、更に15時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、3ーメトキシー1ーメチルー5ートリフルオロメチルー1Hーピラゾール9.8g(収率90.7%)を得た。

<参考例24>

4-クロロメチルー3-メトキシー1-メチルー5-トリフルオロメチルー1 H-ピラゾールの製造

15

0g(5.6ミリモル)の酢酸25ml溶液に、パラホルムアルデヒド0.45g(ホルムアルデヒド換算15.0ミリモル)及び濃塩酸5mlを加え80℃で2時間加熱攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ炭酸カリウムを用いて中和した後、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン一酢酸エチル混合溶媒)で精製し4ークロロメチルー3ーメトキシー1ーメチルー5ートリフルオロメチルー1Hーピラゾール0.83g(収率65.0%)を得た。

<参考例25>

10 5 ーフルオロー1ーメチルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4 ーカルボアルデヒドの製造

5-クロロー1ーメチルー3ートリフルオロメチルー1 Hーピラゾールー4ーカルボアルデヒド60.4g(282.7ミリモル)のジメチルスルホキシド700ml溶液に、ふっ化カリウム42.0g(711.9ミリモル)を加え、120~140℃で5時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、5ーフルオロー1ーメチルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ー36.8g(収率66.0%)を得た。

20 <参考例 26>

(5-フルオロー1-メチルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4 ーイル)-メタノールの製造

水素化ホウ素ナトリウム3.9g(102.6ミリモル)のメタノール500m1 に溶液、氷冷下、5ーフルオロー1ーメチルー3ートリフルオロメチルー1Hーピ 25 ラゾールー4ーカルボアルデヒド36.8g(187.6ミリモル)のメタノール2 00m1溶液を加えた。0℃で30分間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を2 に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(5-フルオロ-1-メラルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4-イル)-メタノール35.

5 4g(収率95.4%)を得た。

<参考例27>

4ーブロモメチルー5ーフルオロー1ーメチルー3ートリフルオロメチルー1 Hーピラゾールの製造

5-フルオロー1-メチルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4

10 -メタノール35.4g(178.7ミリモル)のジエチルエーテル500ml溶液を一30℃に冷却し、三臭化りん54.0g(199.5ミリモル)を加えた。室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、4-プロモメチルー5-フルオロー1-メチルー3-15トリフルオロメチルー1H-ピラゾール31.4g(収率80.8%)を得た。

<参考例28>

(エトキシカルボニル)マロンジアルデヒドの製造

水素化ナトリウム12.6g(純度60%、525.0ミリモル)をジエチルエーテルで数回デカントした後、ジエチルエーテル500m1溶液とした。そして、窒 素気流下、0~10℃で、ギ酸エチル194g(2.6モル)および3,3ージエトキシープロピオン酸エチルエステル50g(262.0ミリモル)を加えた。その後、室温で15時間攪拌し、反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、ジエチルエーテルで洗浄した。得られた水層を塩酸でpH1とした後、ジクロロメタンで抽出した。更に、得られた有機層を食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧 下溶媒を留去し、濃赤色油状の(エトキシカルボニル)マロンジアルデヒドの粗化合

物37.6g(収率100%)を得た。

(1 H-NMR値 (CDC1 $_{3}$ /TMS δ (ppm)) : 9.09(2H, s), 5.26(1H, s), 4.27(2H, q), 1.28(3H, t)

<参考例29>

5 1 Hーピラゾールー4ーカルボン酸エチルエステルの製造

(エトキシカルボニル)マロンジアルデヒド27.6g(192ミリモル)のエタノール150ml溶液に氷冷下、ヒドラジン6.2g(193ミリモル)を加え、室温で17時間攪拌した。その後、減圧下エタノールを留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ジクロロメタンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し

10 黄色結晶の1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステル19.4g(72.4%)を得た

(1 H-NMR値 (CDC1₃/TMS δ (ppm)) : 8.08(2H, s), 5.30(1H, s), 4.31(2H, q),

1.36(3H, t)

<参考例30>

15 1ーエチルー1Hーピラゾールー4ーカルボン酸エチルエステルの製造
1Hーピラゾールー4ーカルボン酸エチルエステル1.5g(10.7ミリモル)
のN, Nージメチルホルムアミド50ml溶液に無水炭酸カリウム3.7g(26.8ミリモル), ヨウ化エチル4.2g(26.6ミリモル)を加え、室温で20時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた20 有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン一酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色油状物の1ーエチルー1Hーピラゾールー4ーカルボン酸エチルエステル1.6g(収率88.9%)を得た。

(1 H-NMR値(CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 7.90(2H, s), 4.28(2H, q), 4.18(2H, q),

25 1.51(3H, t), 1.35(3H, t)

<参考例31>

3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステルの製造

1-エチルー1H-ピラゾールー4-カルボン酸エチルエステル1.6g(9.5 ミリモル), N-クロロこはく酸イミド 5.1g(38.3ミリモル)をガラス封管に入れ、160℃で6時間反応させた。反応終了後、室温まで冷却し、反応物を四塩化炭素およびクロロホルムで洗浄、減圧ろ過した。得られたろ液(有機層)を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶10 媒)で精製し、黄色油状物の3,5-ジクロロー1-エチルー1H-ピラゾールー4ーカルボン酸エチルエステル1.0g(収率44.2%)を得た。

(1 H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 4.36(2H, q), 4.21(2H,

q), 1.44(3H, t), 1.38(3H, t)

<参考例32>

15 (3,5-ジクロロー1-エチルー1H-ピラゾールー4ーイル)メタノールの製

水素化リチウムアルミニウム 0.16g(4.2ミリモル)のテトラヒドロフラン70m 1 溶液を-50℃に冷却し、3,5-ジクロロ-1-エチルー1H-ピラゾールー4-カルボン酸エチルエステル 1.0g(4.2ミリモル)のテトラヒドロフラン30m 1 溶液をゆっくり滴下し、更に-50℃で3時間攪拌した。反応終了確認後、酢酸エチルを加えて、しばらく攪拌した後、更に水を加え、しばらく攪拌した。減圧ろ過し、ろ液を酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、茶色油状物の(3,5-ジクロロ-1-エチルー1H-ピラゾールー4-イル)メタノール 0.8

25 2 g (収率100%)を得た。

(1 H-NMR値(CDC1 $_3$ /TMS δ (ppm)): 4.52(2H, s), 4.16(2H, q), 1.43(3H, t) <参考例 3 3 >

- 4-プロモメチルー3, 5-ジクロロー1-エチルー1 H-ピラゾールの製造 (3,5-ジクロロー1-エチルー1 H-ピラゾールー4-イル)メタノール0.
- 5 82g(4.2ミリモル)のジエチルエーテル50mI溶液を-30℃に冷却し、三臭化リン1.3g(4.8ミリモル)を加え、更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、黄色油状物の4-ブロモメチル-3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール0.
- 10 9 g (収率 8 1.8%)を得た。

(1 H-NMR値(CDC1 $_3$ /TMS δ (ppm)): 4.33(2H, s), 4.13(2H, q), 1.43(3H, t) <参考例 3 4 >

3 - ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-5-オールの製造 ジフルオロアセト酢酸エチルエステル30.0g(180.6ミリモル)のエタノ

- 15 一ル200m1溶液にメチルヒドラジン8.3g(180.6ミリモル)及び濃塩酸 5m1を加えた後、2日間加熱還流した。反応終了後、減圧下溶媒を大部分留去した。残渣を水中に注ぎクエン酸でpH4とした後、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:へキ サンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1日
- 20 サンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H -ピラゾール-5-オール8.9g(収率33.3%)を得た。

<参考例35>

5 ー クロロー 3 ー ジフルオロメチルー 1 ー メチルー 1 H ー ピラゾールー 4 ー カルボアルデヒドの製造

25 N, N-ジメチルホルムアミド7.9g(108.0ミリモル)に、氷冷下、オキシ

塩化リン41.6g(270.1ミリモル)を加えた。次に、室温で3-ジフルオロメチルー1ーメチルー1Hーピラゾールー5ーオール8.0g(54.0ミリモル)を加えた後、4時間加熱還流した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を水、5%水酸化ナトリウム水溶液及ぴ水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、白色結晶の5ークロロー3ージフルオロメチルー1ーメチルー1Hーピラゾールー4ーカルボアルデヒド7.7g(収率73.3%)を得た。(¹H-NMR値(CDC1₃/TMS δ (ppm)):9.96(1H, s), 6.90(1H, t, J=53.6Hz), 3.93(3H, s)

10 <参考例36>

(5-クロロー3-ジフルオロメチルー1-メチルー1H-ピラゾールー4-イル)-メタノールの製造

5-クロロー3-ジフルオロメチルー1-メチルー1H-ピラゾールー4ーカルボアルデヒド7.2g(37.0ミリモル)のメタノール100m1溶液を0℃に 15 冷却し、水素化ホウ素ナトリウム2.1g(55.5ミリモル)を徐々に加え、更に室温で3時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(5-クロロー3-ジフルオロメチルー1-メチルー1H-ピラゾールー4-イル)-メタノール3.8g(収率52.1%)を得た。

20 (1 H-NMR値(CDCl₃/TMS δ (ppm)):6.70(1H, t, J=40.8Hz), 4.63(2H, s), 3.86(3H, s), 1.79(1H, br)

<参考例37>

4ープロモメチルー5ークロロー3ージフルオロメチルー1ーメチルー1Hー ピラゾールの製造

25 (5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イ

ル)ーメタノール2.0g(10.0ミリモル)のジエチルエーテル50m1溶液を一 10℃に冷却し、三臭化リン1.0g(3.5ミリモル)を加え、更に室温で一夜攪拌 した。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られ た有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を 留去し、4ープロモメチルー5ークロロー3ージフルオロメチルー1ーメチルー1 Hーピラゾール2.6g(収率100.0%)を得た。

<参考例38>

5

トリフルオロアセトアルデヒドオキシムエーテレートの製造

トリフルオロアセトアルデヒドへミエチルアセタール50.0g(347.0ミリ 10 モル)のメタノール80m1溶液に、ヒドロキシルアミン塩酸塩24.1g(347.0ミリモル)、水160m1を加え、氷冷下、50%水酸化ナトリウム水溶液 80.0g(1.7モル)を滴下した。滴下終了後室温で6時間攪拌した。反応終了 後、10%塩酸を加えてpH6とし、ジエチルエーテルで抽出した。減圧下溶媒を 留去し、残渣を蒸留し、トリフルオロアセトアルデヒドオキシムエーテレート24. 7g(収率38.0%)を得た。

<参考例39>

トリフルオロアセトヒドロキシモイルブロミドエーテレートの製造

トリフルオロアセトアルデヒドオキシムエーテレート24.7g(131.7ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド50m1溶液に、氷冷下、Nーブロモこは20 く酸イミド38.8g(218.0ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド125m1溶液を加え、室温で3時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣を蒸留し、褐色油状物質のトリフルオロアセトヒドロキシモイルブロミドエーテレート33.3g(収率95.0%)25を得た。

(1 H-NMR値(CDC1 $_{\star}$ TMS δ (ppm)): 9.30(1H, s)

<参考例40>

4-エトキシカルボニル-5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾー ルの製造

- 5 アセト酢酸エチル6.7g(51.3ミリモル)のメタノール80m1溶液に、ナトリウムメトキシド2.8g(51.3ミリモル)を加え、氷冷下、トリフルオロアセトヒドロキシモイルプロミドエーテレート5.0g(18.8ミリモル)のメタノール20m1溶液を加えた。室温で3時間攪拌した。反応終了後、減圧下溶媒を留去し、水を加え、クロロホルムで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、
- 10 無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色油状物質の4-エトキシカルボニルー5-メチルー3ートリフルオロメチルイソキサゾール2.9g(収率69.0%)を得た。

('H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 4.36(2H, q), 2.77(3H, s), 1.37(3H, t) <参考例41>

(5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール-4-イル)-メタノー ルの製造

水素化リチウムアルミニウム 0.16g(4.2ミリモル)のTHF 15m 1溶液を0℃に冷却し、4-エトキシカルボニル-5-メチル-3-トリフルオロメチル 7/1 15m 1溶液を徐々に加えた。 10℃で1時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルを加えてしばらく攪拌した後、水を加え、しばらく攪拌した。減圧ろ過し、ろ液をジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール-4-イル)

25 ーメタノール O.5 g (収率 6 O.0%) を得た。

(¹H-NMR値 (CDC1₃/TMS δ (ppm)): 4.60(2H, d), 2.54(3H, s), 1.66(1H, br) <参考例 4.2 >

4ープロモメチルー5ーメチルー3ートリフルオロメチルイソキサゾールの製造

5 (5-メチルー3ートリフルオロメチルイソキサゾールー4ーイル)ーメタノール0.45g(2.5ミリモル)のジエチルエーテル10ml溶液を0℃に冷却し、三臭化りん0.2g(8.9ミリモル)を加えた。室温で1時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、4ーブロモメチルー5ーメチルー3ートリフルオロメチルイソキサゾール0.5g(収率74.0%)を得た。

(¹H-NMR値·(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 4.31(2H, d), 2.51(3H, s) <参考例 4.3 >

(5-クロロー3ーメチルーイソチアゾールー4ーイル)ーメタノールの製造 水素化リチウムアルミニウム0.42g(11.0ミリモル)のテTHF10m1 溶液に、-30℃で5ークロロー3ーメチルーイソチアゾールー4ーカルボン酸エチルエステル2.06g(10.0ミリモル)のTHF10m1溶液を滴下し、更に同温度で1時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液に酢酸エチルを加えた後、水中にあけ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、 無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、(5ークロロー3ーメチルーイソチアゾールー4ーイル)ーメタノール1.50g(収率91.5%)を得た。

<参考例44>

4-クロロメチルー5-クロロー3-メチルイソチアゾールの製造

(9.15ミリモル)のクロロホルム10m1溶液に、室温で塩化チオニル3.26g(27.44ミリモル)を加え3時間攪拌した。反応終了確認後、減圧下溶媒を留去し、4ークロロメチルー5ークロロー3ーメチルイソチアゾール1.67g(収率定量的)を得た。

5 <参考例45>

4-トリフルオロメチルニコチン酸メチルエステルの製造

4ートリフルオロメチルニコチン酸 4.6 g(24.1ミリモル)のN, Nージメチルホルムアミド70ml溶液に、無水炭酸カリウム6.7 g(48.6ミリモル), ヨウ化メチル6.9 g(48.6ミリモル)を加え、室温で12時間攪拌した。反応終10 了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色油状物の4ートリフルオロメチルニコチン酸 メチルエステル2.77 g(収率56.1%)を得た。

15 (1 H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 9.11(1H, s), 8.92(1H, d), 7.6 4(1H, d), 3.99(3H, s)

<参考例46>

(4-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-メタノールの製造

水素化リチウムアルミニウム 0.37g(9.7ミリモル)のTHF 100m 1溶 20 液を-50℃に冷却し、4ートリフルオロメチルニコチン酸メチルエステル 2.0 g(9.8ミリモル)のTHF 30m 1溶液をゆっくり滴下し、更に-50℃で3時間攪拌した。反応終了確認後、酢酸エチルを加えて、しばらく攪拌した後、更に水を加え、再度しばらく攪拌した。反応混合物を減圧ろ過し、ろ液を酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥 した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶

媒: ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色油状物の(4-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)メタノール 0.6 g (収率 35.3%)を得た。 (1 H-NMR値 (CDC1 $_2$ /TMS δ (ppm)) : 9.00(1H, s), 8.73(1H, d), 7.51(1H, d),

5 <参考例47>

4.95(2H, s)

3-ブロモメチルー4-トリフルオロメチルピリジンの製造

(4-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)メタノール0.6g (3.4ミリモル)のジエチルエーテル50ml溶液を-30℃に冷却し、三臭化リン1.4g (5.2ミリモル)を加え、更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶 液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、黄色油状物の3-ブロモメチルー4-トリフルオロメチルピリジン0.61g(収率75.3%)を得た。 (『H-NMR値(CDC1』/TMS δ(ppm)): 8.88(1H,s), 8.73(1H,d), 7.54(1H,d), 4.63(2H,s)

15 <参考例48>

5 ープロモー4 ーヒドロキシー6 ートリフルオロメチルピリミジンの製造 4 ーヒドロキシー6 ートリフルオロメチルピリミジン49.2g(300.0ミリ モル)の酢酸600ml溶液に、室温で無水酢酸ナトリウム77.5g(945.0ミリモル)を加えた。更に45℃で反応溶液中に臭素50.3g(315ミリモル)を 20 徐々に加え、同温度で3時間攪拌した。反応終了確認後、減圧下溶媒を留去した。 残渣を水にあけ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗 浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をnーへ キサンで洗浄し5 ープロモー4 ーヒドロキシー6 ートリフルオロメチルピリミジ ン38.9g(収率53.4%)を得た。

25 <参考例49>

5ープロモー4ークロロー6ートリフルオロメチルピリミジンの製造
5ープロモー4ーヒドロキシー6ートリフルオロメチルピリミジン24.3g
(100.0ミリモル)をオキシ塩化リン18.5g(120.0ミリモル)に懸濁させ、
100℃で2時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を徐々に水にあけクロロホ
ルムで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、5ープロモー4ークロロー6ートリフルオロメチルピリミジン21.5g(収率82.4%)を得た。

<参考例50>

5ープロモー4ーメトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンの製造
 5ープロモー4ークロロー6ートリフルオロメチルピリミジン21.5g(82.2ミリモル)のメタノール100ml溶液に、室温でナトリウムメトキシド16.7ml(28%メタノール溶液 86.4ミリモル)を加え攪拌した。反応終了確認後、減圧下溶媒を留去した。残渣を水にあけ、クロロホルムで抽出した。得られた15 有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をnーヘキサンで洗浄し、5ープロモー4ーメトキシー6ートリフルオロメチルピリミジン19.2g(収率91.0%)を得た。

<参考例51>

5ープロモー4ーエトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンの製造
 5ープロモー4ークロロー6ートリフルオロメチルピリミジン3.00g(11.48ミリモル)のエタノール50ml溶液に、室温でナトリウムエトキシド0.94g(13.77ミリモル)を加え攪拌した。反応終了確認後、減圧下溶媒を留去した。 残渣を水にあけ、クロロホルムで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次 洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリ カゲルカラムクロマトグラフィーで精製し5ープロモー4ーエトキシー6ートリ

フルオロメチルピリミジン2.44g(収率82.9%)を得た。 <参考例52>

4-メトキシー6-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボアルデヒドの 製造

(1 H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 10.41(1H,q), 8.98(1H,s), 4.18(3H,s)

'15 <参考例53>

4-エトキシー6-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボアルデヒドの 製造

5ーブロモー4ーエトキシー6ートリフルオロメチルピリミジン5.76g(21.3ミリモル)のTHF250ml溶液を一78℃に冷却し、nーブチルリチム202.6ml(1.6mol/l nーヘキサン溶液 36.1ミリモル)を滴下し、40分間攪拌した。ギ酸メチル2.7g(45.1ミリモル)を加え、更に1.5時間攪拌した。反応終了後、塩化アンモニウム水溶液を加え、ジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘ25キサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、4ーエトキシー6ートリフルオロメチル

ピリミジンー 5 一カルボアルデヒド 3 .8 2 g (収率 8 1 .6 %)を得た。 (1 H-NMR値(CDC1 $_3$ /TMS δ (ppm)): 10 .41 (1H, s), 8 .95 (1H, s), 4 .63 (2H, q), 1 .48 (3H, t)

<参考例54>

5 (4ーメトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンー5ーイル)ーメタノールの製造

4ーメトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンー5ーカルボアルデヒド1.3g(6.3ミリモル)のメタノール30ml溶液に、室温で水素化ホウ素ナトリウム0.24g(6.3ミリモル)を徐々に加え3時間攪拌した。反応終了確認後、水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、(4ーメトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンー5ーイル)ーメタノール0.42g(収率32.1%)を得た。

(1 H-NMR値(CDC1₃/TMS δ (ppm)):8.93(1H, s), 4.81(2H, s), 4.13(3H, s),

15 2. 26 (1H, br)

<参考例55>

(4-エトキシー6ートリフルオロメチルピリミジン-5-イル) -メタノール の製造

水素化ホウ素ナトリウム1.7g(45.7ミリモル)のメタノール50m1溶液20 に、氷冷下、4-エトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンー5ーカルボアルデヒド3.82g(17.2ミリモル)のメタノール50m1溶液を加え、更に0℃で1時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(4-エトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンー5ーイル)ー25 メタノール3.77g(収率97.8%)を得た。

($^{1}\text{H-NMR値}$ (CDCl $_{3}$ /TMS δ (ppm)) : 8.80(1H, s), 4.81(2H, s), 4.59(2H, q), 2.28(1H, b), 1.48(3H, t)

<参考例56>

5-クロロメチルー4-メトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンの製造 (4-メトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンー5-イル)ーメタノール 0.42g(2.02ミリモル)のクロロホルム10m1溶液に、室温で塩化チオニル 1.19g(10.1ミリモル)を加え3時間攪拌した。反応終了確認後、減圧下溶媒を留去し、5-クロロメチルー4-メトキシー6-トリフルオロメチルピリミジン 0.45g(収率:定量的)を得た。

10 <参考例57>

5ーブロモメチルー4ーエトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンの製造 (4ーエトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンー5ーイル)ーメタノール 3.77g(17.0ミリモル)のジエチルエーテル50ml溶液を0℃に冷却し、三臭化りん2.0g(7.2ミリモル)を加えた。室温で1時間攪拌した。生じた塩をメタノールで溶解し、更に1時間攪拌した。反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、5ーブロモメチルー4ーエトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンの粗化合物を得た。

(1 H-NMR値(CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 8.79(1H, s), 4.61(2H, q), 4.55(2H, s),

20 1.49(3H, t)

<参考例58>

(2ークロロー4ーメチルピリジン-3ーイル)メタノールの製造

水素化リチウムアルミニウム 0.4 g (1 0.0ミリモル)のテトラヒドロフラン 30m1懸濁液に、-65~-60℃でメチル 2-クロロー4-メチルニコチン 25 酸1.9 g (1 0.0ミリモル)のTHF 5.0m1溶液を徐々に加えた後、30分間

20

25

攪拌した。更に20℃で、1時間攪拌した。反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、(2-クロロ-4-メチルピリジン-3-イル)メタノール0.6g(収率38.2%)を得た。

(1 H-NMR値 (CDC1 $_{3}$ /TMS δ (ppm)) : 8.19(1H, d), 7.08(1H, d), 4.85(2H, s), 2.49(3H, s)

<参考例59>

3-アセチルー4-クロロメチルー2,5-ジクロロチオフェンの製造

3ーアセチルー2,5ージクロロチオフェン5.0g(32.4ミリモル)のクロロメチルメチルエーテル26ml(323.0ミリモル)溶液に、氷冷下10℃での四塩化チタン(2mol/1ジクロロメタン溶液)33ml(66.0ミリモル)を滴下した。その後室温で2時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を重曹及び水、食塩水で順次洗浄した後、無水15 硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=9/1)で精製し、黄色結晶の3ーアセチルー4ークロロメチルー2,5ージクロロチオフェン2.6g(収率39.7%)を得た。

(¹H—NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 4.70 (2H, s), 2.56 (3H,s), 2.54 (3H,s) 2.39(3H, s)

<参考例60>

3ープロモー2ープロモメチルベンゾフランの製造

3 ープロモー2ーメチルベンゾフラン2.8 g(13.3ミリモル)のモノクロロベンゼン30ml溶液に、Nープロモコハク酸イミド2.7 g(15.3ミリモル)及びアゾビスイソプチロニトリル0.4 g(2.7ミリモル)を加えた後、80℃で30

分間攪拌した。原料消失を確認した後、反応溶液を室温にまで冷却した。不溶物を 適別し、濾液を減圧下溶媒を留去した。残渣を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。 得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し た。減圧下溶媒を留去し、3ープロモー2ープロモメチルベンゾフラン3.0g(収 率79.0%)を得た。

<参考例61>

25

1-ジフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステルの 製造

1 Hーピラゾールー4ーカルボン酸エチルエステル3.0g(21.4ミリモル)

10 のN, Nージメチルホルムアミド100m1溶液に、無水炭酸カリウム6.0g(43.5ミリモル)を加え、クロロジフルオロメタンを反応溶液に吹き込み、130~140℃で3時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色透明油状物の1ージフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーカルボン酸エチルエステル1.67g(収率41.0%)を得た。

(1 H-NMR値 (CDCl $_{3}$ /TMS δ (ppm)) : 8. 32(1H, s), 8. 04(1H, s), 7. 20(1H, t), 4. 32(2H, q), 1. 37(3H, t)

20 本発明の除草剤は、一般式 [I] で示されるイソオキサゾリン誘導体及これを有効成分としてなる。

本発明化合物を除草剤として使用するには本発明化合物それ自体で用いてもよいが、製剤化に一般的に用いられる担体、界面活性剤、分散剤又は補助剤等を配合して、粉剤、水和剤、乳剤、フロアブル剤、微粒剤又は粒剤等に製剤して使用することもできる。

製剤化に際して用いられる担体としては、例えばタルク、ベントナイト、クレー、カオリン、珪藻土、ホワイトカーボン、バーミキュライト、炭酸カルシウム、消石灰、珪砂、硫安、尿素等の固体担体、イソプロピルアルコール、キシレン、シクロヘキサン、メチルナフタレン等の液体担体等があげられる。

5 界面活性剤及び分散剤としては、例えばアルキルベンゼンスルホン酸金属塩、ジナフチルメタンジスルホン酸金属塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルアリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、ポリオキシエチレングリコールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンソルビタンモノアルキレート等があげられる。補助剤としては、例えばカルボキシメチルセルロース、ポリエチレングリコール、アラビアゴム等があげられる。使用に際しては適当な濃度に希釈して散布するか又は直接施用する。

本発明の除草剤は茎葉散布、土壌施用又は水面施用等により使用することができる。有効成分の配合割合については必要に応じて適宜選ばれるが、粉剤又は粒剤とする場合は0.01~10%(重量)、好ましくは0.05~5%(重量)の範囲から適宜選ぶのがよい。乳剤及び水和剤とする場合は1~50%(重量)、好ましくは5~30%(重量)の範囲から適宜選ぶのがよい。又、フロアブル剤とする場合は1~40%(重量)、好ましくは5~30%(重量)の範囲から適宜選ぶのがよい。

本発明の除草剤の施用量は使用される化合物の種類、対象雑草、発生傾向、環境 20 条件ならびに使用する剤型等によってかわるが、粉剤及び粒剤のようにそのまま使 用する場合は、有効成分として1~クタール当り1g~50kg、好ましくは10g~10kgの範囲から適宜選ぶのがよい。又、乳剤、水和剤及びフロアブル剤と する場合のように液状で使用する場合は、0.1~50,000ppm、好ましく は10~10,000pmの範囲から適宜選ぶのがよい。

25 又、本発明の化合物は必要に応じて殺虫剤、殺菌剤、他の除草剤、植物生長調節

剤、肥料等と混用してもよい。

次に代表的な製剤例をあげて製剤方法を具体的に説明する。化合物、添加剤の種類及び配合比率は、これのみに限定されることなく広い範囲で変更可能である。以下の説明において「部」は重量部を意味する。

5 〈製剤例1〉 水和剤

化合物 (3-0006) の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、βーナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5 部、珪藻土の20部、クレーの69部を混合粉砕し、水和剤を得た。

〈製剤例2〉 フロアブル剤

10 粗粉砕した化合物 (3-0006) 20部を水69部に分散させ、ポリオキシエチレンスチレン化フェニルエーテル硫酸塩4部、エチレングリコール7部を加えるとともにシリコーンAF-118N (旭化成工業株式会社製)を製剤に対し200ppm加え、高速攪拌機にて30分間混合した後、湿式粉砕機にて粉砕しフロアブル剤を得た。

15 〈製剤例3〉 乳剤

化合物(3-0006)の30部にキシレンとイソホロンの等量混合物60部、 界面活性剤ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアル キルアリールポリマー及びアルキルアリールスルホネートの混合物の10部を加 え、これらをよくかきまぜることによって乳剤を得た。

20 〈製剤例4〉 粒剤

25

化合物(3-0006)の10部、タルクとベントナイトを1:3の割合で混合した増量剤の80部、ホワイトカーボンの5部、界面活性剤ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキルアリールポリマー及びアルキルアリールスルホネートの混合物の5部に水10部を加え、よく練ってペースト状としたものを直径0.7mmのふるい穴から押し出して乾燥した後に0.5~1m

mの長さに切断し、粒剤を得た。

次に試験例をあげて本発明化合物の奏する効果を説明する。

〈試験例1〉 水田土壌処理による除草効果試験

100cm²プラスチックポットに水田土壌を充填し、代掻後、タイヌビエ、コナギの種子を播種し、水深3cmに湛水した。翌日、製剤例1に準じて調製した水和剤を水で希釈し、水面滴下した。施用量は、有効成分を、1へクタール当り100gとした。その後、温室内で育成し、処理後21日目に表21の基準に従って除草効果を調査した。結果を表22に示す。

10

表21

指数	指数 除草効果(生育抑制程度)及び薬害
5	90%以上の抑制の除草効果、薬害
4	70%以上90%未満の除草効果、薬害
3	50%以上70%未満の除草効果、薬害
2	30%以上50%未満の除草効果、薬害
1	10%以上30%未満の除草効果、薬害
0	0%以上10%未満の除草効果、薬害

表22

化合物番号	薬量(g a.i. /ha)	タイヌヒ・エ	コナキ・
1-0001	1000	5	5
1-0002	1000	5	5
1-0003	1000	5	5
1-0004	1000	5	5
1-0005	1000	5	5
2-0001	1000	5	5
2-0003	1000	5	5
2-0004	1000	5	5
2-0005	1000	5	5
2-0006	1000	5	5
2-0008	1000	5	5

WO 02/062770 PCT/JP02/01015

258

•			
2-0011	1000	5	5
2-0012	1000	5	5
3-0002	1000	5	5
3-0004	1000	5	5
3-0009	1000	5	5
3-0013	1000	5	5
3-0014	1000	5	5
3-0015	1000	5	5
3-0016	1000	5	5
3-0034	1000	5	5
3-0035	1000	5	5
3-0037	1000	5	5
3-0038	1000	5	5
3-0039	1000	5	5
3-0040	1000	5	5
3-0041	1000	5	5
3-0044	1000	5	5
3-0047	1000	5	5
3-0049	1000	5	5
3-0051	1000	5	5
3-0054	1000	5	5
3-0059	1000	5	5
3-0060	1000	5	5
3-0061	1000	5	5
3-0070	1000	5	5
3-0072	1000	5	5
3-0073	1000	5	5
3-0074	1000	5	5
3-0081	1000	5	5
3-0082	1000	5	5
3-0083	1000	5	5
3-0084 3-0085	1000	5	5
	1000	5	5
3-0086 3-0087	1000	5	5
3-0087	1000	5	5
3-0088	1000	5	5
3-0089	1000	5	5
3-0090	1000	5	5
3-0091	1000	5	5

		·	
3-0100	1000	5	5
3-0101	1000	5	5
3-0102	1000	5	5
3-0103	1000	5	5
3-0114	1000	5	5
3-0115	1000	5	5
3-0117	1000	5	5
3-0118	1000	5	5
3-0119	1000	5	5
3-0120	1000	. 5	5
3-0121	1000	5	5
3-0124	1000	5	5
3-0125	1000	5	5
3-0126	1000	5	5
3-0127	1000	5	5
3-0128	1000	5	5
3-0129	1000	5	5
3-0130	1000	5	5
3-0131	1000	5	5
3-0134	1000	5	5
3-0135	1000	5	5
3-0137	1000	5	5
3-0139	1000	5	5
3-0144	1000	5	5
3-0153	1000	5	5
3-0156	1000	5	5
3-0160	1000	5	5
3-0173	1000	5	5
3-0174	1000	5	5
3-0176	1000	5	5
3-0177	1000	5	5
3-0178	1000	5	5
3-0180	1000	5	5
4-0001	1000	5	5
4-0002	1000	5	5
4-0005	1000	5	5
4-0007	1000	5	5
4-0008	1000	5	5
5-0001	1000	5	5

5-0002	1000	5	5
5-0003	1000	5	5
5-0005	1000	5	5
5-0006	1000	5	5
5-0007	1000	5	5
6-0003	1000	5	5
6-0004	1000	5	5
7-0004	1000	5	5
7-0006	1000	5	5
7-0008	1000	5	5
7-0009	1000	5	5
8-0001	1000	5	5
8-0012	1000	5	5
9-0001	1000	5	5
9-0003	1000	5	5
9-0005	1000	5	5
9-0006	1000	5	5
9-0008	1000	5	5
10-0002	1000	5	4
10-0003	1000	5 .	5
10-0004	1000	5	5
10-0005	1000	5	5
10-0006	1000	5	5
10-0008	1000	5	5
10-0009	1000	5	5
10-0011	1000	5	5
10-0012	1000	5	5
10-0013	1000	5	5
10-0014	1000	5	5
10-0015	1000	5	5
10-0016	1000	5	5
10-0017	1000	5	5
10-0018	1000	5	5

WO 02/062770

〈試験例2〉 畑地土壌処理による除草効果試験

80 c m²プラスチックポットに畑土壌を充填し、イヌビエ、エノコログサの種子を播種して覆土した。製剤例1に準じて調製した水和剤を水で希釈し、1へクタ

ール当り有効成分が1000gになる様に、1ヘクタール当り10001を小型噴霧器で土壌表面に均一に散布した。その後、温室内で育成し、処理21日目に表21の基準に従って、除草効果を調査した。結果を表23に示す。

5

表23

_	<u>~~</u> ~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~				
	化合物番号	薬量(g a.i. /ha)	イヌピエ	エノコログサ	1
	1-0001	1000	5	5	I
l	1-0002	1000	5	5	ĺ
l	1-0003	1000	5	5	
١	1-0004	1000	5	5	ĺ
١	1-0005	1000	5	5	l
l	1-0006	1000	5	4	l
١	2-0001	1000	5	5	
I	2-0003	1000	5	5	
	2-0004	1000	5	5	
	2-0005	1000	5	5	
۱	2-0006	1000	5	4	
l	2-0007	1000	4	4	ĺ
١	2-0008	1000	5	5	
l	2-0011	1000	5	4	
	2-0012	1000	5	5	
l	3-0002	1000	5	5	
l	3-0004	1000	5	5	
l	3-0006	1000	4	4	
١	3-0008	1000	5	5	
	3-0009	1000	5	5	
١	3-0012	1000	5	5	
١	3-0013	1000	5	5	
l	3-0015	1000	5	5	
l	3-0016	1000	5	5	
	3-0017	1000	5	5	
Ì	3-0018	1000	5	5	
١	3-0019	1000	5	5	
	3-0020	1000	5	5 .	
	3-0034	1000	5	5	
	3-0035	1000	5	5	
l	3-0036	1000	5	5	
	3-0037	1000	5	5	
	3-0038	1000	5	5	
	3-0039	1000	5	5	
1	3-0040	1000	5	5	
	3-0041	1000	5	5	
	3-0043	1000	5	5	
			,		

•			•
3-0044	1000	5	5
3-0047	1000	5	5
3-0048	1000	5	5
3-0049	1000	5	5
3-0050	1000	5	5
3-0053	1000	5	5
3-0054	1000	5	5
3-0054	1000	5	5
3-0056	1000	5	5
3-0059	1000	5	5
3-0060	1000	5	5
3-0063	1000	5	5
3-0070	1000	4	4
3-0072	1000	5	5
3-0073	1000	5	5
3-0074	1000	5	5
3-0081	1000	5	5
3-0082	1000	- 5	5
3-0083	1000	5	5
3-0084	1000	5	5
3-0085	1000	5	5
3-0086	1000	5	5
3-0087	1000	5	5
3-0088	1000	5	4
3-0091	1000	5	5
3-0114	1000	5	5
3-0115	1000	5	5
3-0117	1000	5	5
3-0118	1000	5	5
3-0119	1000	5	5
3-0120	1000	5	5
3-0121	1000	5	5
3-0124	1000	5	5
3-0125	1000	5	5
3-0126	1000	5	5
3-0127	1000	. 5	5
3-0128	1000	5	5
3-0129	1000	5	5
3-0130	1000	5	5

WO 02/062770 PCT/JP02/01015

264

3-0131 1000 5 5 3-0134 1000 5 5 3-0135 1000 5 5 3-0136 1000 5 5 3-0137 1000 5 5 3-0138 1000 4 5 3-0139 1000 5 5 3-0142 1000 5 5 3-0143 1000 5 5 3-0144 1000 5 5 3-0153 1000 5 5 3-0156 1000 5 5 3-0173 1000 5 5 3-0180 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 5-0001 1000 5 5						
3-0135 1000 5 5 3-0136 1000 5 5 3-0137 1000 5 5 3-0138 1000 4 5 3-0139 1000 5 5 3-0142 1000 5 5 3-0143 1000 5 5 3-0144 1000 5 5 3-0153 1000 5 5 3-0156 1000 5 5 3-0173 1000 5 5 3-0180 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5		3-0131	1000	5	5	l
3-0136 1000 5 5 3-0137 1000 5 5 3-0138 1000 4 5 3-0139 1000 5 5 3-0142 1000 5 5 3-0143 1000 5 5 3-0153 1000 5 5 3-0156 1000 5 5 3-0173 1000 5 5 3-0180 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5		3-0134	1000	5	5	ı
3-0137 1000 5 5 3-0138 1000 4 5 3-0139 1000 5 5 3-0142 1000 5 5 3-0143 1000 5 5 3-0144 1000 5 5 3-0153 1000 5 5 3-0156 1000 5 5 3-0173 1000 5 5 3-0180 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0005 1000 5 5		3-0135	1000	5	5	I
3-0138 1000 4 5 3-0139 1000 5 5 3-0142 1000 5 5 3-0143 1000 5 5 3-0144 1000 5 5 3-0153 1000 5 5 3-0156 1000 5 5 3-0173 1000 5 5 3-0180 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 5 5-0007 <t< td=""><td></td><td>3-0136</td><td>1000</td><td>5</td><td>5</td><td>İ</td></t<>		3-0136	1000	5	5	İ
3-0139 1000 5 5 3-0142 1000 5 5 3-0143 1000 5 5 3-0153 1000 5 5 3-0156 1000 5 5 3-0173 1000 5 5 3-0180 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 5-0007 1000 5 5		3-0137	1000	5	5	l
3-0142 1000 5 5 3-0143 1000 5 5 3-0144 1000 5 5 3-0153 1000 5 5 3-0156 1000 5 5 3-0173 1000 5 5 3-0180 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 <t< td=""><td></td><td>3-0138</td><td>1000</td><td>4</td><td>5</td><td>l</td></t<>		3-0138	1000	4	5	l
3-0143 1000 5 5 3-0153 1000 5 5 3-0156 1000 5 5 3-0173 1000 5 5 3-0180 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 4 3 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 <t< td=""><td></td><td>3-0139</td><td>1000</td><td>5</td><td>5</td><td>l</td></t<>		3-0139	1000	5	5	l
3-0144 1000 5 5 3-0153 1000 5 5 3-0156 1000 5 5 3-0173 1000 5 5 3-0180 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 4 3 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 <t< td=""><td></td><td>3-0142</td><td>1000</td><td>5</td><td>5</td><td>l</td></t<>		3-0142	1000	5	5	l
3-0153 1000 5 5 3-0156 1000 5 5 3-0173 1000 5 5 3-0180 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 4 3 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0006 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 7-0009 <t< td=""><td></td><td>3-0143</td><td>1000</td><td>5</td><td>5</td><td>l</td></t<>		3-0143	1000	5	5	l
3-0156 1000 5 5 3-0173 1000 5 5 3-0180 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 4 3 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 <t< td=""><td></td><td>3-0144</td><td>1000</td><td>5</td><td>5</td><td>l</td></t<>		3-0144	1000	5	5	l
3-0173 1000 5 5 3-0180 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 4 3 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 <t< td=""><td></td><td>3-0153</td><td>1000</td><td>5</td><td>5</td><td>l</td></t<>		3-0153	1000	5	5	l
3-0174 1000 5 5 3-0180 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 4 3 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 5 5-0006 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 <t< td=""><td></td><td>3-0156</td><td>1000</td><td>5</td><td>5</td><td></td></t<>		3-0156	1000	5	5	
3-0180 1000 5 5 4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 4 3 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5		3-0173	1000	5	5	
4-0001 1000 5 5 4-0001 1000 4 3 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5		3-0174	1000	5	5	l
4-0001 1000 4 3 4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5		3-0180	1000	5	5	
4-0002 1000 5 5 4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 5 5-0006 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5		4-0001	1000	5	5	
4-0005 1000 5 5 4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0006 1000 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5		4-0001	1000	4	3	
4-0006 1000 5 5 4-0007 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 4 5-0005 1000 5 5 5-0006 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5	ı	4-0002	1000	5	5	
4-0007 1000 5 5 4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 5 5-0006 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0006 1000 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5		4-0005	1000	5	5	
4-0008 1000 5 5 5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 4 5-0006 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0006 1000 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5		4-0006	1000	5	5	
5-0001 1000 5 5 5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 4 5-0006 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5	I	4-0007	1000	5	5	
5-0002 1000 5 5 5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 4 5-0006 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0006 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5			1000	5	5	
5-0003 1000 5 5 5-0005 1000 5 4 5-0006 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 5 7-0006 1000 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5		5-0001	1000	5	5	
5-0005 1000 5 4 5-0006 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 4 7-0006 1000 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5			1000	5	5	
5-0006 1000 5 5 5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 4 7-0006 1000 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5	Į	5-0003	1000	5	5	
5-0007 1000 5 5 6-0001 1000 5 5 6-0003 1000 5 5 6-0004 1000 5 5 7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 4 7-0006 1000 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5	I		1000	5	4	i
6-0001 1000 5 5 5 6 6-0003 1000 5 5 5 7-0002 1000 5 5 5 7-0006 1000 5 5 5 7-0007 1000 5 5 7-0008 1000 5 5 5 7-0009 1000 5 5 5 8-0001 1000 5 5 5	١	5-0006	1000	5	5	
6-0003	I		· •	5	5	
6-0004 1000 5 5 5 7-0002 1000 5 5 5 7-0004 1000 5 5 5 7-0006 1000 5 5 5 7-0007 1000 5 5 5 7-0008 1000 5 5 5 7-0009 1000 5 5 5 8-0001 1000 5 5 5	١			ŀ		
7-0002 1000 5 5 7-0004 1000 5 4 7-0006 1000 5 5 7-0007 1000 5 4 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5	١			5	5	
7-0004 1000 5 4 7-0006 1000 5 5 7-0007 1000 5 4 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5	I			5	5	
7-0006 1000 5 5 7-0007 1000 5 4 7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5	l	7-0002	1000	5	5	
7~0007 1000 5 4 7~0008 1000 5 5 7~0009 1000 5 5 8~0001 1000 5 5	l	7-0004	1000	5	4	
7-0008 1000 5 5 7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5	۱	7-0006	1000	5	5	
7-0009 1000 5 5 8-0001 1000 5 5	١	7-0007	1000	5	4	
8-0001 1000 5 5	l	7-0008	1000	5	5	
1 1 1	١	7-0009	1000	5	5	
8~0004 1000 5 5	١	8-0001	1000	5	5	
		8~0004	1000	5	5	

8-0005	1000	- 5	4
8-0007	1000	5	5
9-0001	1000	5	5
9-0005	1000	5	4
9-0006	1000	5	4 .
9-0007	1000	4	4
9-0008	1000	- 5	5
10-0003	1000	5	5
10-0004	1000	· 5	5
10-0005	1000	5	5
10-0006	1000 .	5	4
10-0009	1000	5	5
10-0012	1000	5	4
10-0013	1000	5	5
10-0014	1000	5	5
10-0015	1000	5	5
10-0016	1000	5	4
10-0017	1000	5	5
10-0018	1000	5	5

〈試験例3〉 畑地茎葉処理による除草効果試験

80cm²プラスチックポットに砂を充填し、イヌビエ、エノコログサの種子を 播種し、温室内で2週間育成後、製剤例1に準じて調製した水和剤を水に希釈し、 5 1ヘクタール当り有効成分が1000gになる様に、1ヘクタール当り10001 を小型噴霧器で植物体の上方から全体に茎葉散布処理した。その後、温室内で育成 し、処理14日目に表21の基準に従って、除草効果を調査した。結果を表24に 示す。

表24

化合物番号	薬量(g a.i. /ha)	イヌヒ ・エ	エノコロク・サ
1-0001	1000	5	4
1-0004	1000	5	4
2-0001	1000	5	4
2-0003	1000	5	4
2-0004	1000	5	4
2-0008	1000	5	5
2-0011	1000	5	4
3-0008	1000	4	4
3-0010	1000	5	4
3-0011	1000	5	4
3-0013	1000	5	5
3-0015	1000	5	4
3-0035	1000	4	4
3-0036	1000	4	4
3-0037	1000	5	4
3-0038	1000	5	5
3-0039	1000	5	5
3-0044	1000	5	4
3-0049	1000	4	4
3.0073	1000	5	4
3-0074	1000	5	4
3-0076	1000	· 5	4
3-0077	1000	5	4
3-0081	1000	4	4
3-0082	1000	4	4
3-0083	1000	4	4
3-0084	1000	4	4
3-0085	1000	4	4
3-0086	1000	4	4
3-0092	1000	4	4
3-0104	1000	5	4
3-0105	1000	5	4
3-0106	1000	5	4
3-0107	1000	5	5
3-0115	1000	5	4
3-0118	1000	5	4
3-0119	1000	5	4

PCT/JP02/01015

	_	_	
3-0120	1000	5	5
3-0144	1000	5	5
4-0002	1000	5	4
4-0005	1000	5	4
5-0001	1000	5	4
5-0002	1000	5	5
5-0003	1000	5	4
5-0007	1000	5	. 5
6-0004	1000	5	4
7-0008	1000	5	5
7-0009	1000	4	4
8-0001	1000	5	4
9-0001	1000	4	4
9-0005	1000	4	4
9-0008	1000	4	4

産業上の利用可能性

一般式[I]で表される本発明の化合物は、畑地において問題となる種々の雑草、例えばオオイヌタデ (Polygonum lapathifolium L. subsp. nodosum (Pers.)

5 Kitam.) 、アオビコ (Amaranthus viridis L.)、シロザ (Chenopodium album L.)、ハコベ (Stellaria media (L.) Villars)、イチビ (Abutilon theophrasti Medik.)、アメリカキンゴジカ (Sida spinosa)、アメリカツノクサネム (Sesbaria exaltata)、アサガオ (Ipomoea spp.)、オナモミ (Xanthium strumarium L.)等の広葉雑草をはじめ、ハマスゲ (Cyperus rotundus L.)、キハマスゲ (Cyperus esculentus)、10 ヒメクグ (Kyllinga brevifolia Rottb. subsp. leiolepis (Fraxch. et Savat.) T. Koyama)、カヤツリグサ (Cyperus microiria Steud.)、コゴメガヤツリ (Cyperus iria L.)等の多年生および1年生カヤツリグサ科雑草、ヒエ (Echinochloa crusgalli (L.) Beauv. var. crus-galli)、メヒシバ (Digitaria ciliaris (Retz.) Koeler)、エノコログサ (Setaria viridis (L.) Beauv.)、スズメノカタビラ (Poa annua L.)、ジョンソングラス (Sorghum halepense (L.) Pers.)、ノスズメノテ

WO 02/062770 PCT/JP02/01015

268

ッポウ (Alopecurus myosuroides Huds) 、野生エンバク (Aveua fatua L.)等のイネ科雑草の発芽前から生育期の広い範囲にわたって優れた除草効果を発揮する。また、水田に発生するタイヌビエ (Echinochloaoryzicola Vasing.) 、タマガヤツリ (Cyperus difformis L.) 、コナギ (Monochoria vaginalis (Burm. f.) Presl. var. plantaginea (Roxb.) Solms-Laub.) 、アゼナ (Lindernia procumbens) 等の一年生雑草及びウリカワ (Sagittaria trifolia L.) 、オモダカ (Sagittaria pygmaea Miq.)、ミズガヤツリ (Cyperus serotinus Rottb.)、クログワイ (Eleocharis kuroguwai Ohwi) 、ホタルイ (Scirpus juncoides Roxb. subsp. hotarui (Ohwi) T. Koyama) 、ヘラオモダカ (Alisma canaliculatum) 等の多年生雑草を防除すること もできる。

一方、本発明の除草剤は作物に対する安全性も高く、中でもイネ、コムギ、オオムギ、トウモロコシ、グレインソルガム、ダイズ、ワタ、テンサイ等に対して高い安全性を示す。

請求の範囲

1. 一般式 [I] を有するイソオキサゾリン誘導体又はその薬理上許容される塩:

5 式中、

R¹及びR²は、同一又は異なって、水素原子、C1~C10アルキル基、C3~C8シクロアルキル基又はC3~C8シクロアルキルC1~C3アルキル基を示すか、或いはR¹とR²とが一緒になって、これらの結合した炭素原子と共に形成したC3~C7のスピロ環を示し、

10 R³及びR⁴は、同一又は異なって、水素原子、C1~C10アルキル基又はC3~C8 シクロアルキル基を示すか、或いはR³とR⁴とが一緒になって、これらの結合した 炭素原子と共に形成したC3~C7のスピロ環を示し、更にR¹、R²、R³及びR⁴は これらの結合した炭素原子と共に5~8 員環を形成することもでき、

R⁵及びR⁶は、同一又は相異なって、水素原子又はC1~C10アルキル基を示し、 Yは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子より選択される1以上の任意のヘテロ原子 を有する5~6員の芳香族ヘテロ環基又は芳香族ヘテロ縮合環基を示し、これらの ヘテロ環基は置換基群 αより選択される、0~6個の同一又は相異なる基で置換さ れていてもよく、又、隣接したアルキル基同士、アルコキシ基同士、アルキル基と アルコキシ基、アルキル基とアルキルチオ基、アルキル基とアルキルスルホニル基、 20 アルキル基とモノアルキルアミノ基又はアルキル基とジアルキルアミノ基が2個 結合して1~4個のハロゲン原子で置換されてもよい5~8員環を形成されてい てもよく、又、これらのヘテロ環基のヘテロ原子が窒素原子の時は酸化されてNー

オキシドになってもよく、

nは0~2の整数を示す。

「置換基群α」

水酸基、チオール基、ハロゲン原子、C1~C10アルキル基、置換基群βより選 5 択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル 基、C3~C8シクロアルキル基、C1~C10アルコキシ基、置換基群γより選択さ れる任意の基でモノ置換されたC1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロアルコキシ 基、C3~C8シクロアルキルオキシ基、C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキル オキシ基、C1~C10アルキルチオ基、置換基群ッより選択される任意の基でモノ 置換されたC1~C10アルキルチオ基、C1~C4ハロアルキルチオ基、C2~C6ア 10 ルケニル基、C2~C6アルケニルオキシ基、C2~C6アルキニル基、C2~C6アル キニルオキシ基、C1~C10アルキルスルフィニル基、置換基群ッより選択される 任意の基でモノ骨換されたC1~C10アルキルスルフィニル基、C1~C10アルキル スルホニル基、置換基群ッより選択される任意の基でモノ置換されたCI~C10ア ルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルフィニル基、置換基群γより選択 15 される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルスルホニルオキシ基、C1~C 4ハロアルキルスルホニル基、C1~C10アルキルスルホニルオキシ基、C1~C4 ハロアルキルスルホニルオキシ基、置換されていてもよいフェニル基、置換されて いてもよいフェノキシ基、置換されていてもよいフェニルチオ基、置換されていて もよい芳香族へテロ環基、置換されていてもよい芳香族へテロ環オキシ基、置換さ 20 れていてもよい芳香族へテロ環チオ基、置換されていてもよいフェニルスルフィニ ル基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族 ヘテロ環スルホニル基、置換されていてもよいフェニルスルホニルオキシ基、アシ ル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボ ニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、カルボキシル基、C1~C10アルコ 25

キシカルボニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい。)、C1~C6アシルオキシ基、C1~C4ハロアルキルカルボニルオキシ基、置換されていてもよいベンジルカルボニルオキシ基、置換されていてもよいベンジルカルボニルオキシ基、置換されていてもよいベンゾイルオキシ基、二トロ基、アミノ基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい、)

「置換基群 В |

15

20

水酸基、C3~C8シクロアルキル基(該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されてもよい)、C1~C10アルコキシ基、C1~C10アルキルチオ基、C1~C10アルコキシカルボニル基、C2~C6ハロアルケニル基、アミノ基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基で置換されていてもよい)、カルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基で置換されていてもよい)、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基で置換されていてもよい)、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C10アルコキシイミノ基、シアノ基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基

「置換基群ッ」

25 C1~C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換さ

15

20

25

れていてもよい芳香族へテロ環基、シアノ基、カルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基で置換されていてもよい。)

2. 0~6個の同一又は相異なる基で置換されていてもよいヘテロ環上の置換基 群 α が、水酸基、ハロゲン原子、 $C1\sim C10$ アルキル基、置換基群 β より選択され る任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C3 ~C8シクロアルキル基、C1~C10アルコキシ基、置換基群γより選択される任意 の基でモノ置換されたC1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロアルコキシ基、C3 ~C8シクロアルキルオキシ基、C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ 基、C1~C10アルキルチオ基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換さ れたC1~C10アルキルチオ基、C1~C4ハロアルキルチオ基、C2~C6アルケニ ル基、C2~C6アルケニルオキシ基、C2~C6アルキニル基、C2~C6アルキニル オキシ基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、 置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、置換され ていてもよいフェニルチオ基、置換されていてもよい芳香族へテロ環基、置換され ていてもよい芳香族へテロ環オキシ基、置換されていてもよい芳香族へテロ環チオ 基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族へ テロ環スルホニル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置 換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、 カルボキシル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基 (該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていて もよいフェニル基で置換されていてもよい。)、ニトロ基、アミノ基(該基の窒素 原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル 基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよ いベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキ ルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベン

ジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい。)であるか、或いは、隣接したアルキル基同士、アルコキシ基同士、アルキル基とアルコキシ基、アルキル基とアルキルチオ基、アルキル基とアルキルスルホニル基、アルキル基とモノアルキルアミノ基又はアルキル基とジアルキルアミノ基が2個結合して1~4個のハロゲン原子で置換されてもよい5~8員環を形成されていてもよい請求項1に記載のイソオキサゾリン誘導体。

- 3. 0~6個の同一又は相異なる基で置換されていてもよいヘテロ環上の置換基群αが、ハロゲン原子、C1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C1~C 10アルコキシC1~C3アルキル基、C3~C8シクロアルキル基(該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されてもよい)、C1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロアルコキシ基、C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ基、置換されていてもよいフェノキシ基、C1~C10アルキルチオ基、C1~C10アルキルスルホニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なってC1~C10アルキル基で置換されていてもよい)である請求項2に記載のイソオキサゾリン誘導体。
 - 4. R^1 及び R^2 が、同一又は異なってメチル基もしくはエチル基、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が水素原子である請求項1、2又は3のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体。
- 20 5. Yが、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子より選択される任意のヘテロ原子を 有する5員環又は6員環の芳香族ヘテロ環基である請求項1、2、3又は4のいず れかに記載のイソオキサゾリン誘導体。
 - 6. Yが、チエニル基、ピラゾリル基、イソキサゾリル基、イソチアゾリル基、 ピリジル基又はピリミジニル基である請求項5に記載のイソオキサゾリン誘導体。
- 25 7. Yが、チオフェン-3ーイル基、ピラゾール-4ーイル基、ピラゾール-5

ーイル基、イソオキサゾールー4ーイル基、イソチアゾールー4ーイル基、ピリジンー3ーイル基又はピリミジンー5ーイル基である請求項6に記載のイソオキサゾリン誘導体。

- 8. Υが、チオフェンー3ーイル基で、置換基群αがチオフェン環の2及び4位 に置換した請求項7に記載のイソオキサゾリン誘導体。
- Υが、ピラゾールー4ーイル基で、置換基群αがピラゾール環の3及び5位 9. に、更に1位に水素原子、C1~C10アルキル基、置換基群 B より選択される任意 の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C3~C8 シクロアルキル基、C2~C6アルケニル基、C2~C6アルキニル基、C1~C10ア ルキルスルフィニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、置換基群γより選択さ 10 れる任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロア ルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳 香族へテロ環基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていても よい芳香族へテロ環スルホニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、 置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、 15 C1~C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボ ニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、カルバモイル基(該基の 窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていてもよいフ ェニル基で置換されていてもよい)、アミノ基(該基の窒素原子は同一又は異なっ て、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、アシル基、C1~C 20 4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換 されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロ アルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換され ていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい)が置換した請求項7
- 25 に記載のイソオキサゾリン誘導体

- Υが、ピラゾールー5ーイル基で、置換基群αがピラゾール環の4位に、 更に1位に水素原子、C1~C10アルキル基、置換基群βより選択される任意の基 でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C3~C8シク ロアルキル基、C2~C6アルケニル基、C2~C6アルキニル基、C1~C10アルキ ルスルフィニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、置換基群γより選択される 5 任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキ ルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族 ヘテロ環基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい 芳香族へテロ環スルホニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置 換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、 10 C1~C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボ ニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、カルバモイル基(該基の 窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていてもよいフ ェニル基で置換されていてもよい)、アミノ基(該基の窒素原子は同一又は異なっ て、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、アシル基、C1~C 15 4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換 されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロ アルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換され ていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい)が置換した請求項7 に記載のイソオキサゾリン誘導体。 20
 - 11. Υが、イソオキサゾールー4ーイル基で、置換基群 α がイソオキサゾール 環の3位及び5位に置換した請求項7に記載のイソオキサゾリン誘導体。
 - 12. Υが、イソチアゾールー4ーイル基で、置換基群αがイソチアゾール環の 3位及び5位に置換した請求項7に記載のイソオキサゾリン誘導体。
- 25 13. Υが、ピリジン-3-イル基で、置換基群αがピリジン環の2位及び4位

に置換した請求項7に記載のイソオキサゾリン誘導体。

- 14. Yが、ピリミジンー5ーイル基で、置換基群αがピリミジン環の4位及び6位に置換した請求項7に記載のイソオキサプリン誘導体。
- 15. nが2である請求項1~14のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体。
- 5 16. nが1である請求項1~14のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体。
 - 17. nが0である請求項1~14のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体。
 - 18. 請求項1~17のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体又は薬理上許容される塩を有効成分として含有する除草剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No. PCT/JP02/01015

Int.	IFICATION OF SUBJECT MATTER C1 ⁷ C07D261/10, 261/12, 413/12 20, 487/04, A01N43/80	, 498/04, 513/04, 413/1	4, 417/12,		
According to	International Patent Classification (IPC) or to both na	tional classification and IPC	+		
	SEARCHED				
Minimum de	ocumentation searched (classification system followed	by classification symbols)			
	Cl ⁷ C07D261/10, 261/12, 413/12 20, 487/04, A01N43/80	, 498/04, 513/04, 413/1	4, 417/12,		
Documentat	ion searched other than minimum documentation to the	extent that such documents are included	in the fields searched		
Jitsu Kokai	yo Shinan Koho 1992—1996 Jitsuyo Shinan Koho 1971—2002	Jitsuyo Shinan Toroku Kob Toroku Jitsuyo Shinan Kob	o 1996–2002 o 1994–2002		
	ata base consulted during the international search (name (STN) , REGISTRY (STN)	e of data base and, where practicable, sea	rch terms used)		
•					
C. DOCU	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT				
Category*	Citation of document, with indication, where ap	propriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.		
Y	JP 9-328483 A (Sankyo Co., L		1-8,11,13		
A	22 December, 1997 (22.12.97), Claims		15-18 9,10,12,14		
A	(Family: none)	·	3,23,22,23		
Y	WO 00/50410 A1 (Nippon Soda 31 August, 2000 (31.08.00),	Co.),	1-3,5-8,11,13 15-18		
	Full text	2000-297080 A			
	& AU 200026912 A & JP	2000-297000 A			
Y	WO 99/23094 Al (Nippon Soda 14 May, 1999 (14.05.99),	Co.),	1-8,11,13, 15-18		
•	Full text & EP 1031537 A1 & BR	9814832 A			
	& AU 9896505 A & US	6147031 A	,		
	& CN 1278259 A & JP	11-240872 A			
- Furth	er documents are listed in the continuation of Box C.	See patent family annex.			
* Specia	l categories of cited documents: ent defining the general state of the art which is not	"I" later document published after the inte priority date and not in conflict with the			
conside	ered to be of particular relevance	understand the principle or theory und	erlying the invention		
date	date considered novel or cannot be considered to involve an inventive				
cited to	cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is				
"O" docum					
"P" document published prior to the international filing date but later "&" document member of the same patent family than the priority date claimed					
	actual completion of the international search	Date of mailing of the international sear			
U9 P	09 April, 2002 (09.04.02) 23 April, 2002 (23.04.02)				
Name and r	nailing address of the ISA/	Authorized officer			
	Japanese Patent Office				
Facsimile No.		Telephone No.			

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1998)

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP02/01015

	V-124-14-14-14-14-14-14-14-14-14-14-14-14-14				
	関する分野の分類(国際特許分類(IPC)) 1 ⁷ C07D261/10,261/12,4 413/14,417/12,261/2				
	「つた分野 最小限資料(国際特許分類(I P C)) 1 ⁷ C O 7 D 2 6 1/10, 2 6 1/12, 4 4 1 3/14, 4 1 7/12, 2 6 1/2		4,		
日本国実用 日本国公開 日本国実用	トの資料で調査を行った分野に含まれるもの 新案公報 1992-1996年 実用新案公報 1971-2002年 新案登録公報 1996-2002年 実用新案公報 1994-2002年				
国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語) CAS (STN), REGISTRY (STN)					
C. 関連する	ると認められる文献		•		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連すると	ときは、その関連する箇所の表示・	関連する 請求の範囲の番号		
Y	JP 9-328483 A (三共和 1997.12.22, 【特許請求の		1-8 11, 13 15-18		
A ·		·	9, 10 12, 14		
C欄の続きにも文献が列挙されている。					
もの 「E」国際出版 以後にな 「L」優先権 日若し、 文献(「O」ロ頭に、		の日の後に公表された文献 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって 出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論 の理解のために引用するもの 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明 の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以 上の文献との、当業者にとって自明である組合せに よって進歩性がないと考えられるもの 「&」同一パテントファミリー文献			
国際調査を完	了した日 09.04.02	国際調査報告の発送日 23.04.0	2		
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁(ISA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号		特許庁審査官 (権限のある職員) 荒木 英則 (評) 電話番号 03-3581-1101	4C 3127 内線 3450		

玉	**	詞	*	椒	<u> </u>
133	577	БΗ	æ	412	6

国際出願番号 PCT/JP02/01015

C (続き).						
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号				
Y	WO 00/50410 A1 (NIPPON SODA CO) 2000.08.31,全文, & AU 200026912 A & JP 2000-297080 A	1-3 5-8 11, 13 15-18				
Y	WO 99/23094 A1 (NIPPON SODA CO) 1999.05.14,全文, & EP 1031573 A1 & BR 9814832 A & AU 9896505 A	1-8 11, 13 15-18				
	& US 6147031 A & CN 1278259 A & JP 11-240872 A					
		341				

THIS PAGE BLANK (USPTO)